



PCT

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM

Internationales Büro

INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

| | | |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (51) Internationale Patentklassifikation ⁴ : A23K 1/16 | A1 | (11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 89/10701 (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 16. November 1989 (16.11.89) |
| (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP89/00477 | | (81) Bestimmungsstaaten: AT (europäisches Patent), BE (europäisches Patent), CH (europäisches Patent), DE (europäisches Patent), FR (europäisches Patent), GB (europäisches Patent), IT (europäisches Patent), LU (europäisches Patent), NL (europäisches Patent), SE (europäisches Patent), US. |
| (22) Internationales Anmeldedatum: 29. April 1989 (29.04.89) | | |
| (30) Prioritätsdaten: P 38 15 344.0 5. Mai 1988 (05.05.88) DE | | (71) Anmelder (<i>für alle Bestimmungsstaaten ausser US</i>): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Carl-Bosch-Straße 38, D-6700 Ludwigshafen (DE). |
| (72) Erfinder;und (75) Erfinder/Anmelder (<i>nur für US</i>) : EULER, Klaus [DE/DE]; Maxstraße 65, D-6700 Ludwigshafen (DE). LECHTKEN, Peter [DE/DE]; Ludwigshafener Straße 6 B, D-6710 Frankenthal (DE). FRANZ, Lothar [DE/DE]; Sternstraße 197, D-6700 Ludwigshafen (DE). HOPPE, Peter, Paul [DE/DE]; Am Hauenstein 13, D-6706 Wachenheim (DE). SCHOENER, Franz-Josef [DE/DE]; Poststraße 26, D-6732 Edenkoben (DE). | Veröffentlicht <i>Mit internationalem Recherchenbericht.</i> | |
| (54) Title: SUBSTANCES BASED ON URACIL-DERIVATES FOR STIMULATING GROWTH AND REDUCING FAT IN ANIMALS | | |
| (54) Bezeichnung: MITTEL AUF DER BASIS VON URACIL-DERIVATEN ZUR WACHSTUMSFÖRDERUNG UND FETTREDUKTION BEI TIERN | | |
| (57) Abstract | | |
| Said substances also improve the assimilation of food and the proteinabsorption in animals. They contain at least one uracil-derivate or one physiologically tolerated salt thereof. | | |
| (57) Zusammenfassung. | | |
| Es werden Mittel zur Wachstumsförderung und Fettreduktion sowie zur Steigerung der Futterverwertung und des Proteinansatzes bei Tieren vorgeschlagen, die mindestens ein Uracil-Derivat oder ein physiologisch verträgliches Salz davon enthalten. | | |

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Code, die zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

| | | | | | |
|----|--------------------------------|-----|-----------------------------------|----|--------------------------------|
| AT | Österreich | FI | Finnland | MR | Mauritanien |
| AU | Australien | FR | Frankreich | MW | Malawi |
| BB | Barbados | GA | Gabon | NL | Niederlande |
| BE | Belgien | GB | Vereinigtes Königreich | NO | Norwegen |
| BF | Burkina Fasso | HU | Ungarn | RO | Rumänien |
| BG | Bulgarien | IT | Italien | SD | Sudan |
| BJ | Benin | JP | Japan | SE | Schweden |
| BR | Brasilien | KP | Demokratische Volksrepublik Korea | SN | Senegal |
| CF | Zentrale Afrikanische Republik | KR | Republik Korea | SU | Soviet Union |
| CG | Kongo | LJ | Liechtenstein | TD | Tschad |
| CH | Schweiz | LK | Sri Lanka | TG | Togo |
| CM | Kamerun | LUX | Luxemburg | US | Vereinigte Staaten von Amerika |
| DE | Deutschland, Bundesrepublik | MC | Monaco | | |
| DK | Dänemark | MG | Madagaskar | | |
| ES | Spanien | ML | Malí | | |

Mittel auf der Basis von Uracil-Derivaten zur Wachstumsförderung und Fettreduktion bei Tieren

Beschreibung

5

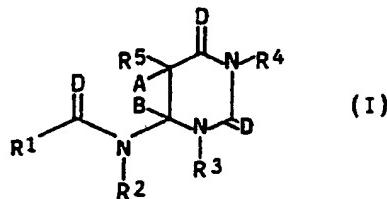
Die Erfindung betrifft ein Mittel auf der Basis von Uracil-Derivaten und deren Verwendung zur Wachstumsförderung, Steigerung der Futterverwertung und des Proteinansatzes sowie zur Fettreduktion bei Tieren, insbesondere Nutz- und Haustieren.

10

Die Verwendung von Futtermittelzusätzen zur Erzielung höherer Gewichtszusätze, besserter Futterausnutzung und verminderter Fettansatz wird in der Tierernährung insbesondere bei der Mast von Schweinen, Rindern und Geflügel bereits weitgehend praktiziert.

15

Gefunden wurden nun Mittel, enthaltend mindestens ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel I,



in der A und B entweder für ein Wasserstoffatom stehen oder zusammen eine
20 Bindung bilden,

D Sauerstoff oder Schwefel, die Gruppe =NCN oder die Gruppe =NE bedeutet, wobei E eine Phenyl-, Benzyl-, Pyridyl-, C₁-C₄-Alkylgruppe oder gemeinsam mit R¹ die Gruppe -(CH₂)_kN= bedeutet, wobei k die Zahl
25 2 oder 3 darstellt,

R¹, falls D ein Sauerstoffatom ist:

- a) ein Wasserstoffatom oder
- 30 b) eine C₁-C₆-Alkylgruppe, die durch 1 bis 3-Fluor-, Chlor- oder Bromatome, eine Hydroxy-, eine C₁-C₃-Alkoxy-, eine C₂-C₄-Alkanoyloxy-, C₁-C₃-Alkylsulfonyloxy-, eine Aminocarbonyloxy-, eine Mono- oder Di-(C₁-C₃-Alkyl)aminocarbonyloxy-, eine Mercapto-, eine C₁-C₃-Alkylmercapto-, eine Phenylmercapto-, eine Pyridylmercapto-, Pyridazinylmercapto-, Pyrimidinylmercapto-, Pyrazinylmercapto- oder eine

Hr

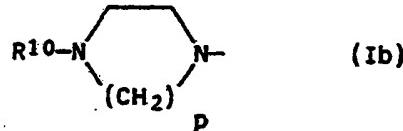
5 Triazinylmercaptogruppe, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine (C_1 - C_4 -Alkoxy)carbonylgruppe, eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C_1 - C_3 -Alkylreste, 1 bis 2 C_1 - C_3 -Alkoxyreste und/oder 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome substituiert sein kann, oder eine Imidazolylgruppe, die durch 1 bis 3 C_1 - C_3 -Alkylgruppen substituiert sein kann, oder eine Gruppe der Formel Ia



10 15 in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, R^6 ein Wasserstoffatom, eine C_1 - C_4 -Alkylgruppe, die gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, eine C_3 - C_6 -Cycloalkylgruppe, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 C_1 - C_4 -Alkylgruppen, 1 oder 2 C_1 - C_4 -Alkoxygruppen oder 1 oder 2 Halogenatome und/oder durch eine Nitril-, Nitro- oder Trifluormethylgruppe substituiert sein kann, oder

15 20 25 eine Gruppe der Formel $R^8R^9N^-$ bedeutet, in der R^8 ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe ist, die 1- bis 2-fach durch Halogenatome, C_1 - C_4 -Alkylreste, C_1 - C_4 -Alkoxygruppen und/oder eine Nitril- und/oder Nitrogruppe substituiert sein kann, R^9 eine C_1 - C_4 -Alkanoyl- oder Benzoylgruppe bedeutet oder R^8 und R^9 zusammen mit dem Stickstoffatom eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe bilden, R^7 dieselben Bedeutungen wie R^6 besitzen kann,

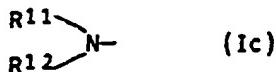
und m für 0, 1 oder 2 steht oder
25 eine Gruppe der Formel Ib



30 worin R^{10} einen C_1 - C_3 -Kohlenwasserstoffrest, der durch einen Naphthylrest oder einen Phenylrest substituiert sein kann, wobei der Phenylrest gegebenenfalls 1 bis 2 Halogenatome, 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkylreste, 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkoxyreste oder eine Trifluormethyl-, Nitro-, Hydroxy-, C_1 - C_4 -Alkanoyl-, (C_1 - C_5 -Alkoxy)-carbonyl- und/oder Cyangruppe enthalten kann, einen Naphthylrest, einen Phenylrest, der 1- bis 3-fach durch Halogenatome, C_1 - C_4 -Alkylreste, C_1 - C_4 -Alkoxygruppen und/oder eine

Trifluormethyl-oder eine C₁-C₄-Alkanoylgruppe substituiert sein kann, oder einen 6-gliedrigen Heteroarylrest mit 1 bis 2 Stickstoffatomen bedeutet und p die Zahl 2 oder 3 darstellt, oder

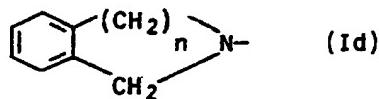
- 5 eine Gruppe der Formel Ic,



worin R¹¹ ein Wasserstoffatom, einen C₁-C₈-Alkylrest, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest, der 1 bis 2 C₁-C₄-Alkylgruppen, 1 bis 2 C₁-C₄-Alkoxygruppen und/oder 1 bis 2 Halogenatome enthalten kann,

- 10 substituiert ist, eine C₃-C₁₂-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen, einen Phenyl-oder Benzylrest substituiert sein kann, oder einen C₇-C₁₀bi-oder tricyclischen Alkylrest, der durch 1 bis 3 Methylreste substituiert sein kann, oder eine benzokondensierte C₅-C₇-Cycloalkylgruppe bedeutet und R¹² ein Wasserstoffatom oder einen C₁-C₈-Alkylrest bedeutet, oder

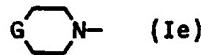
- 15 eine Gruppe der Formel Id,



worin n die Zahl 1, 2 oder 3 bedeutet und der aromatische Ring durch

- 20 1 bis 2 Halogenatome, 1 bis 2 C₁-C₄-Alkylreste oder 1 bis 2 C₁-C₄-Alkoxyreste substituiert sein kann, oder

- 25 eine Gruppe der Formel Ie,



- 30 worin G für Sauerstoff- oder Schwefelatom steht und der heterocyclische Ring durch 1 bis 2 C₁-C₄-Alkylgruppen substituiert sein kann,

darstellt, oder

- 35 c) eine C₂-C₆-Alkenylgruppe bedeutet, die durch 1 Chloratom oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

- d) eine C₃-C₆-Alkinylgruppe darstellt oder
 - e) eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe darstellt, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylgruppen und/oder 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome und/oder durch 5 1 Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
 - f) eine Phenylgruppe darstellt, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylgruppen, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxygruppen, 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome, eine Aminogruppe, eine Mono- oder Di-C₁-C₃-Alkylaminogruppe, eine C₂-C₄-10 Alkanoylaminogruppe, eine Carboxygruppe oder eine C₁-C₄-Alkoxy-carbonylgruppe substituiert sein kann, oder
 - g) eine Pyridyl-, Pyridazinyl-, Pyrimidinyl-, Pyrazinyl- oder Triazinylgruppe darstellt, die durch 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen und/oder eine 15 C₁-C₃-Alkoxygruppe, eine Hydroxygruppe, eine Aminogruppe, eine Mono- oder Di-C₁-C₃-Alkoxygruppe substituiert sein kann, oder
 - h) eine 5-gliedrige aromatische heterocyclische Gruppe darstellt, die als Heteroatome 1 Sauerstoff-, 1 Schwefel- und/oder 1, 2 oder 3 Stickstoffatome enthält und ggf. mit 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen 20 substituiert ist, oder
 - i) eine C₁-C₆-Alkoxygruppe darstellt, die eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, ein bis zwei Chlor- oder Bromatome, eine C₁-C₃-Alkoxygruppe oder eine 25 Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkyl-, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxy-, 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome, einen Trifluormethylrest oder eine Nitrogruppe substituiert sein kann, tragen kann, oder
 - j) eine C₃-C₆-Alkenyloxygruppe darstellt, die durch eine Phenylgruppe 30 substituiert sein kann, oder
 - k) eine C₃-C₆-Alkinyloxygruppe darstellt, die durch einen Phenylrest substituiert sein kann, oder
- 35 l) eine C₃-C₆-Cycloalkyloxygruppe darstellt, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylgruppen und/oder 1 bis 2 Chlor- oder Bromatome substituiert sein kann, oder
- m) eine Phenoxygruppe darstellt, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylreste, 40 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxygruppen, 1 bis 2 Fluor- oder Chloratome oder eine Nitrogruppe substituiert sein kann, oder

n) eine C₁-C₃-Alkylmercaptogruppe darstellt, oder.

o) die Gruppe R¹³R¹⁴N darstellt, wobei R¹³ für ein Wasserstoffatom, eine C₁-C₃-Alkyl-, eine C₃-C₄-Alkenyl- oder eine C₃-C₄-Alkinylgruppe oder 5 eine Phenylgruppe steht und R¹⁴ ein Wasserstoffatom oder eine C₁-C₃-Alkylgruppe bedeutet, oder

R¹, falls D ein Schwefelatom darstellt,

10 e) eine C₁-C₄-Alkylaminogruppe oder eine Di-(C₁-C₄-Alkyl)aminogruppe bedeutet, oder

R¹, falls D die Gruppe =N-CN darstellt, für ein Wasserstoffatom, eine C₁-C₄-Alkylgruppe, eine Phenylgruppe, eine C₁-C₄-Alkylamino- oder eine 15 Di(C₁-C₄-Alkyl)aminogruppe steht, oder

R¹, falls D die Gruppe =NE darstellt, ein Wasserstoffatom, eine C₁-C₄-Alkylgruppe, eine Phenylgruppe, eine Pyridinylgruppe, eine C₁-C₄-Alkinyl-amino- oder eine Di-(C₁-C₄-Alkyl)-aminogruppe bedeutet,

20 f) R² ein Wasserstoffatom oder eine C₁-C₃-Alkylgruppe darstellt,

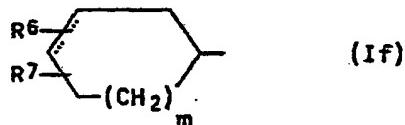
oder R¹ und R² gemeinsam eine C₂-C₄-Alkylidengruppe bilden, die durch 25 I bis 2 C₁-C₃-Alkylgruppen und/oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann,

R³ und R⁴ unabhängig voneinander stehen für

a) ein Wasserstoffatom oder

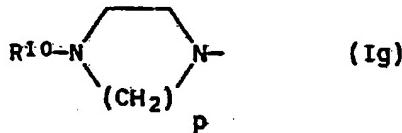
b) eine C₁-C₆-Alkylgruppe, die durch 1 bis 3 Fluor-, Chlor- oder Bromatome, eine Hydroxy-, eine C₁-C₃-Alkoxy, eine C₂-C₄-Alkanoyloxy-, eine C₁-C₃-Alkylsulfonyloxy-, eine Aminocarbonyloxy-, eine Mono- oder 30 Di-(C₁-C₃-Alkyl)aminocarbonyloxy-, eine Mercapto-, eine C₁-C₃-Alkyl-mercpto-, eine Phenylmercpto-, eine Pyridylmercpto-, Pyridazinyl-mercpto-, Pyrimidinylmercpto-, Pyrazinylmercpto- oder eine Triazinylmercaptopgruppe, eine Cyano, eine Carboxy-, eine (C₁-C₄-Alkoxy)carbonylgruppe, eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylreste, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxyreste und/oder 1 bis 2 Fluor-, 35 Chlor- oder Bromatome substituiert sein kann, oder eine Imidazolyl-gruppe, die durch 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen substituiert sein kann, oder 40

eine Gruppe der Formel If,



- in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, R⁶ ein Wasserstoffatom, eine C₁-C₄-Alkylgruppe, die gegebenenfalls durch 5 einen Phenylrest substituiert ist, eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 C₁C₄-Alkylgruppen, 1 oder 2 C₁C₄-Alkoxygruppen oder 1 oder 2 Halogenatome und/oder durch eine Nitril-, Nitro- oder Trifluormethylgruppe substituiert sein kann, oder 10 eine Gruppe der Formel R⁸R⁹N- bedeutet, in der R⁸ ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe ist, die 1- bis 2-fach durch Halogenatome, C₁-C₄-Alkylreste, C₁-C₄-Alkoxygruppen und/oder eine Nitril- und/oder Nitrogruppe substituiert sein kann, R⁹ eine C₁-C₄-Alkanoyl oder eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe darstellt, R⁷ dieselben Bedeutungen wie R⁶ besitzen kann,
15 und m für 0, 1 oder 2 steht oder

eine Gruppe der Formel Ig,

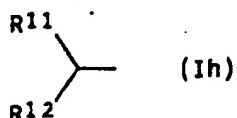


20

25

worin R¹⁰ einen C₁-C₃-Kohlenwasserstoffrest, der durch einen Naphthylrest oder einen Phenylrest substituiert sein kann, wobei der Phenylrest gegebenenfalls 1 bis 2 Halogenatome, 1 bis 2 C₁-C₄-Alkylreste, 1 bis 2 C₁-C₄-Alkoxyreste oder eine Trifluormethyl-, Nitro-, Hydroxy-, 5 C₁-C₄-Alkanyl-, (C₁-C₅-Alkoxy)-carbonyl- und/oder Cyangruppe enthalten kann, einen Naphthylrest, einen Phenylrest, der 1- bis 3-fach durch Halogenatome, C₁-C₄-Alkylreste, C₁-C₄-Alkoxygruppen und/oder eine Trifluormethyl- oder eine C₁-C₄-Alkanoylgruppe substituiert sein kann, oder einen 6-gliedrigen Heteroarylrest mit 1 bis 2 Stickstoffatomen bedeutet und p die Zahl 2 oder 3 darstellt, oder 10

eine Gruppe der Formel I_h,



worin R¹¹ ein Wasserstoffatom, einen C₁-C₈-Alkylrest, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest, der 1 bis 2 C₁-C₄-Alkylgruppen, 1 bis 2 C₁-C₄-Alkoxygruppen und/oder 1 bis 2 Halogenatome enthalten kann, substituiert ist, eine C₃-C₁₂-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen, einen Phenyl- oder Benzylrest substituiert sein kann, oder einen C₇-C₁₀bi oder tricyclischen Alkylrest, der durch 1 bis 3 20 Methylreste substituiert sein kann, oder eine benzokondensierte C₅-C₇-Cycloalkylgruppe bedeutet und R¹² ein Wasserstoffatom oder einen C₁-C₈-Alkylrest bedeutet, oder

- 25 c) eine C₂-C₆-Alkenylgruppe, die durch 1 Chloratom oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- d) eine C₃-C₆-Alkinylgruppe oder
- 30 e) eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylgruppen und/oder 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome und/oder durch 1 Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- f) eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylgruppen, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxygruppen, 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome, eine 35 Aminogruppe, eine Mono- oder Di-C₁-C₃-Alkylaminogruppe, eine C₂-C₄-Alkanoylaminogruppe, eine Carboxygruppe oder eine C₁-C₄-Alkoxy-carbonylgruppe substituiert sein kann, oder

- g) eine Pyridyl-, Pyridazinyl-, Pyrimidinyl-, Pyrazinyl- oder Triazinylgruppe, die durch 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen und/oder eine C₁-C₃-Alkoxygruppe, eine Hydroxygruppe, eine Aminogruppe, eine Mono- oder Di-C₁-C₃-Alkoxygruppe substituiert sein kann, oder
- 5 h) eine 5-gliedrige aromatische heterocyclische Gruppe, die als Heteroatome 1 Sauerstoff-, 1 Schwefel- und/oder 1, 2 oder 3 Stickstoffatome enthält und ggf. mit 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen substituiert ist, oder
- 10 i) eine C₁-C₆-Alkoxygruppe, die eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, ein bis zwei Chlor- oder Bromatome, eine C₁-C₃-Alkoxygruppe oder eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkyl-, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxy-, 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome, einen Trifluormethylrest oder eine Nitrogruppe substituiert sein kann, tragen kann, oder
- 15 j) eine C₃-C₆-Alkenyloxygruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- 20 k) eine C₃-C₆-Alkinyloxygruppe, die durch einen Phenylrest substituiert sein kann, oder
- l) eine C₃-C₆-Cycloalkyloxygruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylgruppen und/oder 1 bis 2 Chlor- oder Bromatome substituiert sein kann, oder
- 25 m) eine Phenoxygruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylreste, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxygruppen, 1 bis 2 Fluor- oder Chloratome oder eine Nitrogruppe substituiert sein kann, oder
- n) eine C₁-C₃-Alkylmercaptogruppe, oder
- 30 o) die Gruppe R¹³R¹⁴N, wobei R¹³ für ein Wasserstoffatom, eine C₁-C₃-Alkyl-, eine C₃-C₄-Alkenyl- oder eine C₃-C₄-Alkinylgruppe oder eine Phenylgruppe steht und R¹⁴ ein Wasserstoffatom oder eine C₁-C₃-Alkylgruppe bedeutet; und
- 35 R⁵
- a) ein Wasserstoffatom
- 40 b) eine C₁-C₆-Alkylgruppe, die durch 1-3 Fluor-, Chlor- oder Bromatome, eine Hydroxy-, eine Cyano- oder Carboxygruppe substituiert sein kann,

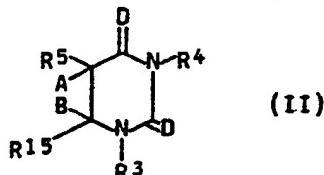
c) ein Halogenatom, oder

d) eine Cyano-, Carboxy-, Nitro-, Nitroso-, Hydroxy- oder Aminogruppe,
die durch ein oder zwei C₁-C₆-Alkylreste mit gegebenenfalls einem
5 Halogenatom oder einer Hydroxygruppe substituiert sein kann,

darstellt;

oder ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel II

10



in der A, B, D, R³, R⁴ und R⁵ die für Formel I angegebenen Bedeutungen besitzen, und

R¹⁵ ein Wasserstoffatom, einen C₁-4-Alkylrest, eine Phenyl-, eine

15 Hydroxy-, eine C₁-4-Alkoxy-, eine Phenoxygruppe, die Gruppe R¹⁸-NH-CH₂-CH(OH)-CH₂O-, in der R¹⁸ die Isopropyl- oder tert.-Butylgruppe bedeutet, eine Nitro-, Trifluormethyl-, Carboxy-, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl- oder Cyanogruppe, ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom, eine

Amino-, C₁-4-Alkylamino-, oder Di(C₁-C₄-Alkyl)-aminogruppe, einen

20 Pyrrolidin-, Piperidin- oder Morphinrest, oder die Gruppe -NH-CH₂-J, wobei J einen Pyridyl-, Furyl-, Thietyl- oder Phenylrest bedeutet, wobei der Phenylrest durch 1 bis 3 Reste aus der Gruppe Halogen, Hydroxy,

C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl oder C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann, oder eine Gruppe -NHL, worin L eine 5- oder 6-gliedrige heterocyclische Gruppe, die

25 1 N-, O- oder S-Atom und gegebenenfalls 1 bis 2 weitere N-Atome besitzt, bedeutet, wobei die heterocyclische Gruppe durch einen Rest aus der Gruppe Cyano, Hydroxy, C₁-C₄-Alkoxy, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di-(C₁-C₄-Alkyl)-

amino, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl, Aminocarbonyl oder C₁-C₄-Alkanoyl oder durch 1 bis 3 C₁-C₄-Alkylgruppen, wobei eine dieser C₁-C₄-Alkylgruppen

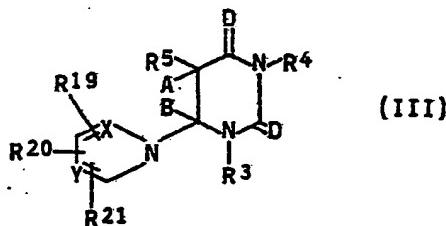
30 durch eine Hydroxygruppe oder den Rest R¹⁹R²⁰N substituiert sein kann, wobei R¹⁹ und R²⁰ unabhängig voneinander Wasserstoffatome,

C₁-C₄-Alkylreste, Benzyl- oder Phenethylgruppen bedeuten

oder die Gruppe $R^{19}R^{20}N$ für eine Pyrrolidin-, Piperidin- oder Morpholinrest steht, substituiert sein kann,

oder ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel III

5



in der R³, R⁴ und R⁵, A und B die für Formel I vorstehend angegebenen Bedeutungen besitzen,

X und Y unabhängig voneinander ein N-Atom oder ein Kohlenstoffatom, das 10 durch ein Wasserstoffatom oder einen der Reste R¹⁹, R²⁰ oder R²¹ substituiert ist, bedeuten, wobei

15 R¹⁹ ein Wasserstoffatom, eine C₁-C₄-Alkylgruppe, eine C₁-C₄-Hydroxyalkylgruppe, eine C₁-C₄-Alkanoyl-, eine Hydroxycarbonyl-, eine (C₁-C₄-Alkoxy)-carbonyl-, eine Aminocarbonyl-, eine Cyanogruppe oder eine Gruppe der Formel IIIa



bedeutet, wobei

20 R²² eine C₁-C₆-Alkyl-, eine Phenyl-(C₁-C₃-Alkyl)-, eine C₁-C₄-Alkanoyl-, eine Benzoyl-, eine Pyridincarbonyl- oder eine C₁-C₄-Alkylsulfonylgruppe bedeutet,

25 R²³ ein Wasserstoffatom oder eine C₁-C₆-Alkylgruppe bedeutet, oder

R²² und R²³ gemeinsam mit dem N-Atom, an das sie gebunden sind, einen Pyrrolidin-, Piperidin- oder Piperazinrest bedeuten, der durch eine Phenylgruppe und/oder eine Hydroxygruppe substituiert sein kann,

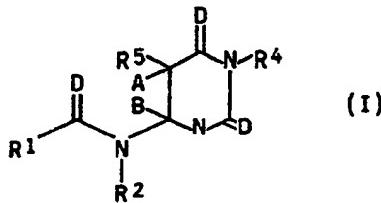
R²⁴ eine C₁-C₄-Alkylidengruppe bedeutet, und

R²⁰ und R²¹ unabhängig voneinander Wasserstoffatome oder C₁-C₄-Alkylgruppen bedeuten,

5

oder die physiologisch verträglichen Salze der Verbindungen der allgemeinen Formeln I, II und III.

Bevorzugte Verbindungen für das erfindungsgemäße Mittel und die 10 erfindungsgemäße Verwendung sind Uracil-Derivate der allgemeinen Formel I,



in der

A und B entweder jeweils ein Wasserstoffatom bedeuten oder zusammen eine Bindung bilden,

15

D ein Sauerstoffatom bedeutet,

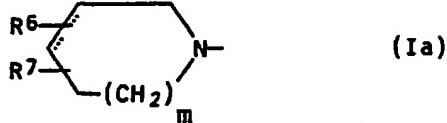
R¹ die folgenden Bedeutungen besitzt:

a) ein Wasserstoffatom oder

20

b) eine C₁-C₃-Alkylgruppe, die durch ein Chloratom, eine Hydroxy-, eine Methoxy-, eine Acetoxy-, eine Methylmercapto-, eine Pyridiylmercapto-, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine (C₁-C₄-Alkoxy)-carbonyl- oder eine Phenylgruppe oder eine Gruppe der Formel Ia,

25



in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, und R⁶ ein Wasserstoffatom, eine Methylgruppe ist, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 Methyl-, Methoxygruppen oder Chloratome

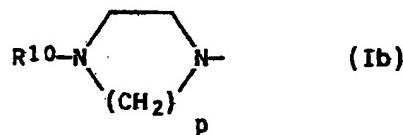
substituiert sein kann, oder eine Gruppe der Formel R⁸R⁹N bedeutet, in der

30 R⁸ ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe und R⁹ eine Propionyl- oder Benzoylgruppe bedeutet oder R⁸ und R⁹ zusammen mit dem Stickstoffatom eine

Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe bilden, R⁷ ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Hydroxy-, eine Acetyl-, eine Ethoxycarbonyl oder eine Cyanogruppe bedeutet,

5 m für I steht oder

eine Gruppe der Formel Ib



worin R¹⁰ einen Benzyl-, einen Naphthyl- oder einen Phenylrest, der 1- bis 10 3-fach durch Chloratome, Methyl- und/oder Methoxygruppen substituiert sein kann, oder einen Pyridylrest bedeutet und

p die Zahl 2 bedeutet, oder

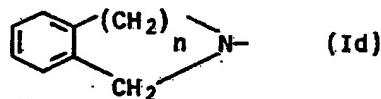
15 eine Gruppe der Formel Ic,



worin R¹¹ einen C₁-C₃-Alkylrest, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, und R¹² ein Wasserstoffatom oder einen Methylrest bedeuten, oder

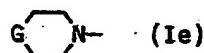
20

eine Gruppe der Formel Id,



worin n die Zahl 2 bedeutet, oder

25 eine Gruppe der Formel Ie,

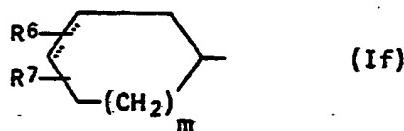


worin G für ein Wasserstoffatom steht und der heterocyclische Ring durch 1 bis 2 C₁-C₄-Alkylgruppen substituiert sein kann, oder

- c) eine C₂-C₄-Alkenylgruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
 - d) eine C₃-C₄-Alkinylgruppe oder
 - e) eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen und/oder 1 bis 2 Chloratome und/oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- 10 f) eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen, 1 bis 2 Methoxygruppen, 1 bis 2 Chloratome, eine Carboxygruppe oder eine Ethoxy-carbonylgruppe substituiert sein kann, oder
- g) eine Pyridylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen substituiert sein kann, oder
 - h) eine Thiophenyl-, Furanyl-, Imidazolyl- oder Oxazolylgruppe, die gegebenenfalls mit 1 bis 3 Methylgruppen substituiert ist, oder
- 20 i) eine C₁-C₄-Alkoxygruppe, die durch eine Methoxygruppe oder durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- j) eine C₃-C₄-Alkenyloxygruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
 - k) eine C₃-C₄-Alkinyloxygruppe, die durch einen Phenylrest substituiert sein kann, oder
 - l) eine C₃-C₆-Cycloalkoxygruppe oder
 - m) eine Phenoxygruppe oder
 - n) eine Methylmercaptogruppe oder
- 35 o) die Gruppe R¹³R¹⁴N-, wobei R¹³ für ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Allyl- oder eine Propionylgruppe steht und R¹⁴ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe bedeutet,
- R² ein Wasserstoffatom bedeutet
- 40 oder R¹ und R² gemeinsam eine C₂-C₄-Alkylidengruppe bilden, die durch 1 bis 2 Methylgruppen substituiert sein kann,

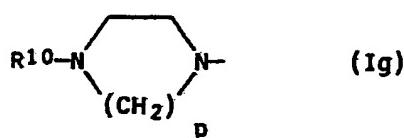
R^3 und R^4 unabhängig voneinander stehen für

- a) ein Wasserstoffatom oder
- 5 b) eine C_1 - C_3 -Alkylgruppe, die durch ein Chloratom, eine Hydroxy-, eine Methoxy-, eine Acetoxy-, eine Methylmercapto-, eine Pyridylmercapto-, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine (C_{1-4} -Alkoxy)-carbonyl- oder eine Phenylgruppe oder eine Gruppe der Formel If,



- 10 in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, und R^6 ein Wasserstoffatom, eine Methylgruppe ist, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 Methyl-, Methoxygruppen oder Chloratome substituiert sein kann, oder eine Gruppe der Formel R^8R^9N bedeutet, in der R^8 ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe und R^9 eine Propionyl- oder Benzoylgruppe bedeutet oder R^8 und R^9 zusammen mit dem Stickstoffatom eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe bilden, R^7 ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Hydroxy-, eine Acetyl-, eine Ethoxycarbonyl- oder eine Cyanogruppe bedeutet,
- 15 20 m für 1 steht oder

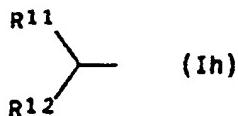
eine Gruppe der Formel Ig,



- 25 worin R^{10} einen Benzyl-, einen Naphthyl- oder einen Phenylrest, der 1- bis 3-fach durch Chloratome, Methyl- und/oder Methoxygruppen substituiert sein kann, oder einen Pyridylrest bedeutet und

p die Zahl 2 bedeutet, oder

eine Gruppe der Formel \mathbb{H}



worin R¹¹ einen C₁-C₃-Alkylrest, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, und R¹² ein Wasserstoffatom oder einen Methylrest bedeuten, oder

5 Methylrest bedeuten, oder

- c) eine C₂-C₄-Alkenylgruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

10 d) eine C₃-C₄-Alkinylgruppe oder

e) eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen und/oder 1 bis 2 Chloratome und/oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

15 f) eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen, 1 bis 2 Methoxygruppen, 1 bis 2 Chloratome, eine Carboxygruppe oder eine Ethoxy-carbonylgruppe substituiert sein kann, oder

20 g) eine Pyridylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen substituiert sein kann, oder

h) eine Thiophenyl-, Furanyl-, Imidazolyl- oder Oxazolylgruppe, die gegebenenfalls mit 1 bis 3 Methylgruppen substituiert ist, oder

25 i) eine C₁-C₄-Alkoxygruppe, die durch eine Methoxygruppe oder durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

j) eine C₃-C₄-Alkenyloxygruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

30 k) eine C₃-C₄-Alkinyloxygruppe, die durch einen Phenylrest substituiert sein kann, oder

35 l) eine C₃-C₆-Cycloalkoxygruppe oder

m) eine Phenoxygruppe oder

n) eine Methylmercaptogruppe oder

a) die Gruppe R¹³R¹⁴N-, wobei R¹³ für ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Allyl- oder eine Propionylgruppe steht und R¹⁴ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe bedeutet; und

5 R⁵

a) ein Wasserstoffatom

b) eine C₁-C₃-Alkylgruppe, die endständig durch ein Fluor-, Chlor-oder
10 Bromatom, eine Hydroxy-, eine Cyano- oder Carboxygruppe substituiert
sein kann,

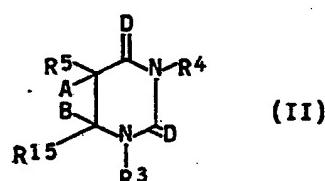
c) ein Brom- oder Chloratom, oder

15 d) eine Cyano-, Carboxy-, Nitro-, Nitroso-, Hydroxy- oder Aminogruppe,
die durch ein oder zwei C₁-C₃ mit gegebenenfalls endständigen Chlor-
atom oder einer Hydroxygruppe substituiert sein kann,

darstellt;

20

oder ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel II



in der

25 A und B entweder jeweils ein Wasserstoffatom bedeuten oder zusammen eine
Bindung bilden,

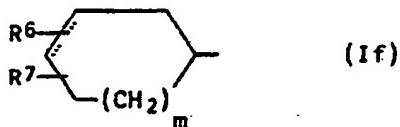
D ein Sauerstoffatom bedeutet,

30 R³ und R⁴ unabhängig voneinander stehen für

a) ein Wasserstoffatom oder

- b) eine C₁-C₃-Alkylgruppe, die durch ein Chloratom, eine Hydroxy-, eine Methoxy-, eine Acetoxy-, eine Methylmercapto-, eine Pyridylmercapto-, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine (C₁-4-Alkoxy)-carbonyl- oder eine Phenylgruppe oder eine Gruppe der Formel If,

5

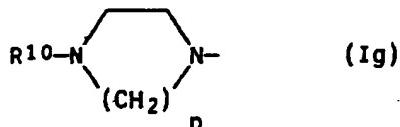


- in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, und R⁶ ein Wasserstoffatom, eine Methylgruppe ist, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 Methyl-, Methoxygruppen oder Chloratome substituiert sein kann, oder eine Gruppe der Formel R⁸R⁹N bedeutet, in der R⁸ ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe und R⁹ eine Propionyl- oder Benzoylgruppe bedeutet oder R⁸ und R⁹ zusammen mit dem Stickstoffatom eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe bilden, R⁷ ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Hydroxy-, eine Acetyl-, eine Ethoxycarbonyl oder eine Cyanogruppe bedeutet,

10

m für 1 steht, oder

eine Gruppe der Formel Ig,

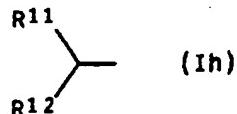


- 20 worin R¹⁰ einen Benzyl-, einen Naphthyl- oder einen Phenylrest, der 1- bis 3-fach durch Chloratome, Methyl- und/oder Methoxygruppen substituiert sein kann, oder einen Pyridylrest bedeutet und

p die Zahl 2 bedeutet, oder

25

eine Gruppe der Formel Ih,



- worin R¹¹ einen C₁-C₃-Alkylrest, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, und R¹² ein Wasserstoffatom oder einen Methylrest bedeuten, oder

- c) eine C₂-C₄-Alkenylgruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

- d) eine C₃-C₄-Alkinylgruppe oder
- e) eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen und/oder 5 1 bis 2 Chloratome und/oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- f) eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen, 1 bis 2 Methoxygruppen, 10 1 bis 2 Chloratome, eine Carboxygruppe oder eine Ethoxy-carbonylgruppe substituiert sein kann, oder
- g) eine Pyridylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen substituiert sein kann, oder
- 15 h) eine Thiophenyl-, Furanyl-, Imidazolyl- oder Oxazolylgruppe, die gegebenenfalls mit 1 bis 3 Methylgruppen substituiert ist, oder
- i) eine C₁-C₄-Alkoxygruppe, die durch eine Methoxygruppe oder durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- 20 j) eine C₃-C₄-Alkenyloxygruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- k) eine C₃-C₄-Alkinyloxygruppe, die durch einen Phenylrest substituiert 25 sein kann, oder
- l) eine C₃-C₆-Cycloalkoxygruppe oder
- m) eine Phenoxygruppe oder
- 30 n) eine Methylmercaptopgruppe oder
- o) die Gruppe R¹³R¹⁴N⁺, wobei R¹³ für ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Allyl- oder eine Propionylgruppe steht und R¹⁴ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe bedeutet; und
- 35 R⁵
- a) ein Wasserstoffatom
- 40 b) eine C₁-C₃-Alkylgruppe, die endständig durch ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom, eine Hydroxy-, eine Cyano- oder Carboxygruppe substituiert sein kann,
- c) ein Brom- oder Chloratom, oder

d) eine Cyano-, Carboxy-, Nitro-, Nitroso-, Hydroxy- oder Aminogruppe, die durch ein oder zwei C₁-C₃ mit gegebenenfalls endständigen Chloratom oder einer Hydroxygruppe substituiert sein kann,

5 darstellt; und

15

a) ein Wasserstoffatom

10

b) einen C₁-C₄-Alkylrest,

c) eine Cyano-, Carboxy- oder Aminogruppe, die durch gegebenenfalls ein bis zwei C₁-C₃-Alkylgruppen substituiert sein kann

15

d) einen Piperidinrest

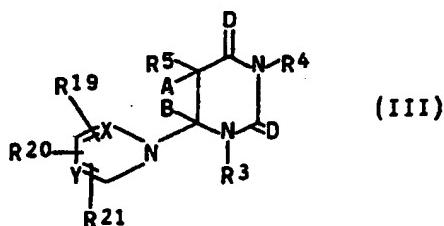
e) die Gruppe NHCH₂J, wobei J ein Pyridiyl-, Furyl-, Thionyl- oder Phenylrest bedeutet,

20

f) die Gruppe NHL, worin L einen Pyridyl- oder einen Thiazolylrest bedeutet, wobei der Pyridyl- oder der Thiazolylrest durch 1-2 Methylgruppen substituiert sein kann,

25 darstellt;

oder ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel III



für der

30

A und B entweder jeweils ein Wasserstoffatom bedeuten oder zusammen eine Bindung bilden,

D ein Sauerstoffatom bedeutet,

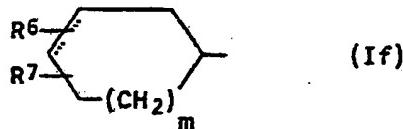
35

R³ und R⁴ unabhängig voneinander stehen für

a) ein Wasserstoffatom oder

- b) eine C₁-C₃-Alkylgruppe, die durch ein Chloratom, eine Hydroxy-, eine Methoxy-, eine Acetoxy-, eine Methylmercapto-, eine Pyridylmercapto-, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine (C₁-4-Alkoxy)-carbonyl- oder eine Phenylgruppe oder eine Gruppe der Formel If,

5

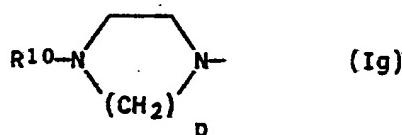


in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, und R⁶ ein Wasserstoffatom, eine Methylgruppe ist, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 Methyl-, Methoxygruppen oder Chloratome substituiert sein kann, oder eine Gruppe der Formel R⁸R⁹N bedeutet, in der R⁸ ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe und R⁹ eine Propionyl- oder Benzoylgruppe bedeutet oder R⁸ und R⁹ zusammen mit dem Stickstoffatom eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe bilden, R⁷ ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Hydroxy-, eine Acetyl-, eine Ethoxycarbonyl oder eine Cyanogruppe bedeutet,

10

m für 1 steht oder

eine Gruppe der Formel Ig,

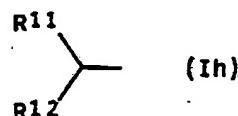


20 worin R¹⁰ einen Benzyl-, einen Naphthyl- oder einen Phenylrest, der 1-bis 3-fach durch Chloratome, Methyl- und/oder Methoxygruppen substituiert sein kann, oder einen Pyridylrest bedeutet und

p die Zahl 2 bedeutet, oder

25

eine Gruppe der Formel Ih



worin R¹¹ einen C₁-C₃-Alkylrest, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, und R¹² ein Wasserstoffatom oder einen Methylrest bedeuten, oder

c) eine C₂-C₄-Alkenylgruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

d) eine C₃-C₄-Alkinylgruppe oder

5

e) eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen und/oder 1 bis 2 Chloratome und/oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

10 f) eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen, 1 bis 2 Methoxygruppen, 1 bis 2 Chloratome, eine Carboxygruppe oder eine Ethoxy-carbonylgruppe substituiert sein kann, oder

g) eine Pyridylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen substituiert sein kann, oder

15

h) eine Thiophenyl-, Furanyl-, Imidazolyl- oder Oxazolylgruppe, die gegebenenfalls mit 1 bis 3 Methylgruppen substituiert ist, oder

20 i) eine C₁-C₄-Alkoxygruppe, die durch eine Methoxygruppe oder durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann,

j) eine C₃-C₄-Alkenyloxygruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

25

k) eine C₃-C₄-Alkinyloxygruppe, die durch einen Phenylrest substituiert sein kann, oder

l) eine C₃-C₆-Cycloalkoxygruppe oder

30

m) eine Phenoxygruppe oder

n) eine Methylmercaptopgruppe oder

35 o) die Gruppe R¹³R¹⁴N-, wobei R¹³ für ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Allyl- oder eine Propionylgruppe steht und R¹⁴ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe bedeutet; und

R⁵

40

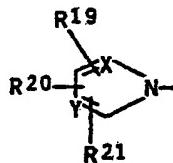
a) ein Wasserstoffatom

b) eine C₁-C₃-Alkylgruppe, die endständig durch ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom, eine Hydroxy-, eine Cyano- oder Carboxygruppe substituiert sein kann,

- c) ein Brom- oder Chloratom, oder
 d) eine Cyano-, Carboxy-, Nitro-, Nitroso-, Hydroxy- oder Aminogruppe,
 die durch ein oder zwei C₁-C₃ mit gegebenenfalls endständigen
 5 Chloratom oder einer Hydroxygruppe substituiert sein kann,
 darstellt;

und der Rest

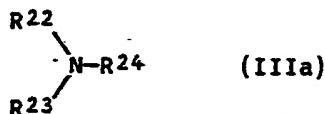
10



insgesamt bedeutet: einen Imidazol-1-yl-rest, der durch 1-3 Methylgruppen oder eine Hydroxymethylgruppe substituiert sein kann,

15

oder einen 1,2,4-Triazol-1-yl-rest, einen Pyrazol-1-yl-rest, einen Pyrazol-1-yl-rest oder einen Pyrrol-1-yl-rest, der durch eine Hydroxymethylgruppe, eine Formylgruppe, eine Acetylgruppe oder eine Gruppe der Formel IIIa,



20

substituiert sein kann, in der R₂₂ eine C₁-C₃-Alkyl-, eine Benzyl-, eine C₁-C₄-Alkanoyl oder eine Benzoylgruppe bedeutet,

R₂₃ ein Wasserstoffatom oder eine C₁-C₆-Alkylgruppe bedeutet, oder

25

R₂₂ und R₂₃ gemeinsam mit dem N-Atom einen Piperidin- oder Piperazinrest darstellen, der durch eine Phenylgruppe substituiert ist,

R₂₄ eine C₁-C₃-Alkylidengruppe bedeutet;

30

oder die physiologisch verträglichen Salze der Verbindungen der allgemeinen Formeln I, II und III.

Das erfindungsgemäße Mittel liegt bevorzugt in Form von Tierfutter, Trinkwasser für Tiere, Zusätzen für Tierfutter und Trinkwasser oder in Form eines Prämixes vor.

Gegenstand der Erfindung ist auch die Verwendung der Uracil-Derivate der allgemeinen Formeln I, II und III zur Leistungssteigerung bei der Tierzucht, insbesondere zur Wachstumsförderung, Verbesserung der Futterverwertung, Erhöhung des Proteinanteils und/oder Verringerung des
5 Fettgehalts bei Tieren.

Herstellverfahren für die im erfindungsgemäßen Mittel eingesetzten Verbindungen sind bekannt und werden zum Beispiel beschrieben in den folgenden Literaturstellen:

10

- a) DE-B 834 105
- b) E.C. Taylor und A. Mc Killop, J. Org. Chem. 30, 3153 (1965)

15

- c) D.T. Hurst, An Introduction to the Chemistry and Biochemistry of Pyrimidines, Purines and Pteridines; Wiley (1980)

- d) D.J. Brown, The Pyrimidines; Wiley (1962);
Suppl. 1 (1970)

20

- Suppl. 2 (1985)

Soweit die Verbindungen der Formeln I, II und III bekannt sind, zeigen sie in bekannter Weise cytostatische, thyreostatische und diuretische Wirkungen.

25

Derartige Wirkungen werden z.B. beschrieben in

30

- 1) M. Negwer, Organisch-chemische Arzneimittel und ihre Synonyma, Akademie-Verlag, Berlin 1978
- 2) den bei den Herstellverfahren genannten Literaturstellen a) bis d).

Überraschend wurde nun gefunden, daß die Verbindungen der allgemeinen Formeln I, II und III eine wachstumsfördernde und fettreduzierende Wirkung
35 besitzen.

Die Wirkstoffe können in allen Bereichen der Tierzucht als Mittel zur Förderung und Beschleunigung des Wachstums, zur Verbesserung der Futterverwertung, Verminderung des Fettansatzes sowie Zunahme des Protein-
40 ansatzes bei gesunden und kranken Tieren verwendet werden.

Die Wirksamkeit der Wirkstoffe ist hierbei weitgehend unabhängig von der Art und dem Geschlecht der Tiere. Besonders wertvoll erweisen sich die Wirkstoffe bei der Aufzucht und Haltung von Jung- und Masttieren. Als

Tiere, bei denen die Wirkstoffe zur Förderung und Beschleunigung des Wachstums und zur Verbesserung der Futterverwertung eingesetzt werden können, seien beispielsweise folgende Nutz- und Ziertiere genannt:

- 5 Warmblüter wie Rinder, Schweine, Pferde, Schafe, Ziegen, Katzen, Hunde, Kaninchen, Pelztiere, z.B. Nerze und Chinchilla, Geflügel, z.B. Hühner, Gänse, Enten, Truthähne, Tauben, Papageien und Kanarienvögel und Kaltblüter wie Fische, z.B. Karpfen und Reptilien, z.B. Schlangen.
- 10 Die Wirkstoffdosis, die den Tieren zur Erreichung des gewünschten Effektes verabreicht wird, kann wegen der günstigen Eigenschaften der Wirkstoffe weitgehend variiert werden. Sie liegt vorzugsweise bei etwa 0,01 bis 100 mg Wirkstoff/kg Futter, insbesondere 0,1 bis 10 mg Wirkstoff/kg Futter oder Trinkwasser. Die Dauer der Verabreichung kann von wenigen Stunden 15 oder Tagen bis zu mehreren Jahren betragen. Die passende Menge des Wirkstoffs sowie die passende Dauer der Verabreichung hängen insbesondere von der Art, dem Alter, dem Geschlecht, dem Gesundheitszustand und der Art der Haltung und Fütterung der Tiere ab und sind von jedem Fachmann leicht zu ermitteln.
- 20 Die Wirkstoffe werden den Tieren nach den üblichen Methoden verabreicht. Die Art der Verabreichung hängt insbesondere von der Art, dem Verhalten und dem Gesundheitszustand der Tiere ab. So kann die Verabreichung einmal oder mehrmals täglich in regelmäßigen oder unregelmäßigen Abständen oral 25 oder parenteral erfolgen. Aus Zweckmäßigkeitsgründen ist in dem meisten Fällen eine orale Verabreichung, insbesondere im Rhythmus der Nahrungs- und/oder Getränkeaufnahme der Tiere, vorzuziehen.
- Die Wirkstoffe können als reine Stoffmischung oder in formulierter Form, 30 also in Mischung mit nichttoxischen inerten Trägerstoffen beliebiger Art, z.B. mit Trägerstoffen und in Formulierungen, wie sie bei nutritiven Zubereitungen üblich sind, verabreicht werden.
- Die Wirkstoffe werden, gegebenenfalls in formulierter Form, zusammen mit 35 pharmazeutischen Wirkstoffen, Mineralsalzen, Spurenelementen, Vitaminen, Eiweißstoffen, Fetten, Farbstoffen und/oder Geschmacksstoffen verabreicht. Empfehlenswert ist die orale Verabreichung zusammen mit dem Futter und/oder Trinkwasser, wobei je nach Bedarf der Wirkstoff der Gesamtmenge oder nur Teilen des Futters und/oder des Trinkwassers zugegeben wird.
- 40 Die Wirkstoffe werden nach üblichen Methoden durch einfaches Mischen als reine Stoffmischung, vorzugsweise in feinverteilter Form oder in formulierter Form in Mischung mit eßbaren nichttoxischen Trägerstoffen, gegebenenfalls in Form eines Praemixes oder eines Futterkonzentrates, dem Futter und/oder Trinkwasser beigefügt.

Die Art des Futters und seine Zusammensetzung ist ohne Belang. Es können alle gebräuchlichen oder speziellen Futterzusammensetzungen verwendet werden, die vorzugsweise das übliche, für eine ausgewogene Ernährung notwendige Gleichgewicht aus Energie- und Aufbaustoffen einschließlich 5 Vitaminen und Mineralstoffen enthalten. Das Futter kann sich beispielsweise zusammensetzen aus pflanzlichen Stoffen, z.B. Heu, Rüben, Getreide, Getreidenebenprodukten, tierischen Stoffen, z.B. Fleisch, Fetten, Knochenmehl, Fischprodukten, Vitaminen, z.B. Vitamin A, D-Komplex und B-Komplex, Proteinen, Aminosäuren, z.B. DL-Methionin und anorganischen Stoffen, z.B. 10 Kalk und Kochsalz.

Futterkonzentrate enthalten die Wirkstoffe neben eßbaren Stoffen, z.B. Roggenmehl, Maismehl, Sojabohnenmehl oder Kalk, gegebenenfalls mit weiteren Nähr- und Aufbaustoffen, sowie Proteinen, Mineralsalzen und 15 Vitaminen. Sie können nach den üblichen Mischnmethoden hergestellt werden.

Vorzugsweise in Praemixen und Futterkonzentraten können die Wirkstoffe gegebenenfalls auch durch ihre Oberfläche bedeckende, geeignete Mittel, z.B. mit nichttoxischen Wachsen oder Gelatine vor Luft, Licht und/oder 20 Feuchtigkeit geschützt werden.

Die Erfindung wird in den nachfolgenden Beispielen weiter erläutert:

Beispiel 1

25 Beispiel für die Zusammensetzung eines Kükenaufzuchtfutters, dem ein erfindungsgemäßer Wirkstoff zugesetzt wird:

| Komponenten | Mais-Soja-Ration % | Gerste-Hafer-Tapioka-Ration % |
|---------------------|--------------------|-------------------------------|
| Mais | 48,0 | |
| 30 Hafer | | 20,00 |
| Gerste | 10,0 | 24,49 |
| Tapioka | | 13,00 |
| Sojaschrot | 31,0 | 31,00 |
| Sojaöl | 3,0 | 5,00 |
| 35 Fischmehl | 2,9 | 3,00 |
| Cefkaphos | 1,76 | 1,76 |
| kohlens. Futterkalk | 1,2 | 1,20 |
| Viehsalz | 0,25 | 0,25 |
| Spurenelement VM | 0,025 | 0,025 |
| 40 Vitamin-VM | 0,025 | 0,025 |
| Cholinchlorid | 0,1 | 0,10 |
| Methionin | 0,15 | 0,15 |
| Weizengrießkleie | 1,59 | |
| | 100,00 | 100,00 |

| Nährstoffgehalte | | |
|------------------|---------------------------------|--------------------------------------------|
| | Mais-Soja-Ration (LuFa Kiel) | Gerste-Hafer-Tapioka-Ration (errechnet) |
| 5 Rohprotein: | 21,8 % | 21,6 % |
| Rohfett: | 6,6 % | |
| Rohfaser: | 3,3 % | |
| MJ ME: | 12,4 | 12,3 |
| EZG: | 82,5 | |
| 10 Ca: | 1,1 % | 1,02 % |
| P: | 0,84 % | 0,88 % |
| Na: | 0,11 % | 0,15 % |
| Lysin: | 1,22 % | 0,51 % |
| Methionin: | 0,66 % | 0,51 % |

15

Beispiel 2

Beispiel für die Zusammensetzung eines Schweineaufzuchtfutters, dem ein erfindungsgemäßer Wirkstoff zugesetzt wird:

20

Zusammensetzung der Futtermischungen (g/kg)

| | Ferkelaufzucht | Mastschweine |
|--------------------------------|----------------|--------------|
| Mais | 350 | 300 |
| 25 Gerste | 153,3 | 270 |
| Tapioka | - | 100 |
| Hafer | - | 100 |
| Sojaschrot | 120 | 150 |
| Fischmehl | - | 40 |
| 30 Weizen | 100 | - |
| Magermilchpulver | 100 | - |
| Weizenkleie | 80 | 4,65 |
| Tierkörpermehl | 40 | - |
| Sojaöl | 30 | - |
| 35 Cefkaphos | 6,83 | 11 |
| Kohlens. Futterkalk | 8,0 | 14,2 |
| Viehsalz | 2,79 | 1,3 |
| Spurenelement VM | 0,8 | 0,6 |
| Vitamin-VM | 3,0 | 4,0 |
| 40 Lysin | 2,5 | 1,0 |
| Methionin | 1,0 | 2,0 |
| Cholinchlorid | 0,8 | 0,25 |
| Cr ₂ O ₃ | 1,0 | 1,0 |

Die angegebenen Futtergemische sind vorzugsweise zur Aufzucht und Mast von Küken bzw. Schweinen abgestimmt, sie können jedoch in gleicher oder ähnlicher Zusammensetzung auch zur Aufzucht und Mast anderer Tiere verwendet werden.

5

Mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen wurden mehrere Fütterungs- und Stoffwechseluntersuchungen durchgeführt.

Beispiel 3

10

Bewertung von Testverbindungen als Wachstumsförderer und körperfett-reduzierende Substanzen in der Tierernährung - Rattentests

a) Tiercharakteristik und Futter

15

Ratten, männlich, SPF-Wistar (Fa. Thomae)

300 Tiere/Versuch (30 x 10)

Gewicht bei Versuchsbeginn: 55 - 65 g

Gewicht bei Versuchsende: 185 - 220 g

20

Futter: Haltungsdiät für Ratten mit folgender Zusammensetzung:

Gehalt

| | | |
|----|------|-------------------|
| 25 | 95 | % Trockensubstanz |
| | 5 | % Rohasche |
| | 13,8 | % Rohprotein |
| | 5,3 | % Rohfett |

30 Rohnährstoffe und Vitamine

| | | |
|----|------|-------------------|
| | 15,1 | % Casein |
| | 10,0 | % Zucker |
| | 3,0 | % Cellulose |
| 35 | 5,0 | % Sojaöl |
| | 6,0 | % Mineralstoff-VM |
| | 2,0 | % Vitamin-VM |
| | 0,2 | % Methionin |
| | 58,7 | % Maisquellstärke |
| 40 | 100 | % |

b) Behandlung der Tiere

Nach Ankunft der Tiere werden diese 3 Tage an die Versuchsbedingungen adaptiert und anschließend randomisiert.

Beispiel für eine Randomisierung

| Körpergewicht | | | | |
|---------------|-----------|--------|------------|--------------------|
| | Gruppe | Anzahl | Mittelwert | Standardabweichung |
| 5 | 1 | 10 | 55,5 | 2,12 |
| | 2 | 10 | 55,5 | 2,27 |
| | 3 | 10 | 55,6 | 2,22 |
| | 4 | 10 | 55,6 | 2,27 |
| | 5 | 10 | 55,5 | 2,27 |
| 10 | 6 | 10 | 55,5 | 2,17 |
| | 7 | 10 | 55,5 | 2,22 |
| | 8 | 10 | 55,6 | 2,27 |
| | 9 | 10 | 55,6 | 2,27 |
| | 10 | 10 | 55,5 | 2,27 |
| 15 | 11 | 10 | 55,5 | 2,07 |
| | 12 | 10 | 55,5 | 2,12 |
| | 13 | 10 | 55,5 | 2,07 |
| | 14 | 10 | 55,4 | 2,01 |
| | 15 | 10 | 55,5 | 2,17 |
| 20 | 16 | 10 | 55,6 | 2,17 |
| | 17 | 10 | 55,7 | 2,21 |
| | 18 | 10 | 55,6 | 2,22 |
| | 19 | 10 | 55,5 | 2,17 |
| | 20 | 10 | 55,5 | 2,22 |
| 25 | 21 | 10 | 55,5 | 2,07 |
| | 22 | 10 | 55,4 | 2,22 |
| | 23 | 10 | 55,6 | 2,17 |
| | 24 | 10 | 55,5 | 2,17 |
| | 25 | 10 | 55,5 | 2,07 |
| 30 | 26 | 10 | 55,5 | 2,17 |
| | 27 | 10 | 55,5 | 2,17 |
| | 28 | 10 | 55,6 | 2,07 |
| | 29 | 10 | 55,6 | 1,96 |
| | 30 | 10 | 55,4 | 2,06 |
| 35 | Gesamt | 300 | 55,5 | 2,06 |
| | Deletiert | 55 | 55,3 | 5,09 |

Die anschließende Testperiode beträgt 21 Tage. Die Tiere werden ad libitum und/oder rationiert (1. Woche 90 g; 2. Woche 110 g; 3. Woche 130 g) gefüttert.

Die Tiere werden einzeln gehalten und in wöchentlichem Abstand gewogen.

Nach Versuchsende werden die Ratten mit CO₂ getötet.

29

Zur Ganzkörperanalyse werden die Tiere einer Versuchsgruppe autoklaviert und anschließend mit einem Kutter homogenisiert.

c) Ergebnisse

5

Die erhaltenen Daten werden nachfolgend tabellarisch dargestellt.

10

15

20

25

30

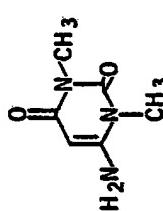
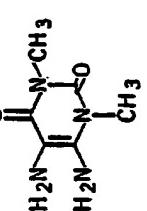
35

40

30

Tabelle 1: Bewertung von Testverbindungen als körperfettreduzierende Substanzen an Ratten
bei rationionierter Fütterung (Versuchsperiode = 21 Tage, 10 Tiere)

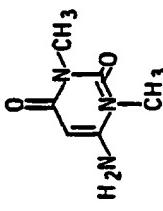
Körperzusammensetzung

| Substanz | Dosierung im Futter [ppm] | Abweichung des Rohprotein gehaltes vgl. zur Kontrolle [%] | Abweichung des Rohfett gehaltes vgl. zur Kontrolle [%] | Protein/Fett [g/g' vgl. zur Kontrolle [%] | Veränderung der Futterverwertung (= g Lebendmassezu- nahme/kg Futter) [%] |
|--------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|--------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|
|  | 10 50 | ± 0 - 3,0 | - 7,6 - 14,0 | 1,458 1,444 1,530 {a} | ± 0 + 0 ± 0 |
|  | 10 50 | - 6,0 - 3,0 | - 16,1 - 0 | 1,522 1,348 1,299 {a} | ± 0 ± 0 ± 0 |

Anmerkung: a) Verhältnis Protein/Fett der Kontrollgruppe beträgt 1,358

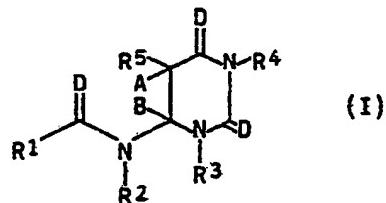
31
I.

**Tabelle 2: Bewertung von Testverbindungen als wachstumsfördernde Substanzen an Ratten
bei ad libitum Fütterung (Versuchsperiode = 21 Tage, 10 Tiere)**

| Substanz | Dosierung im Futter [ppm] | Zuwachs [%] | Verbesserung der Futterverwertung (=g Lebendmassezunahme/kg Futter) [%] |
|-------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------|-------------------------------------------------------------------------------|
|  | 2,5 5,0 | + 4,1 + 6,1 | ± 0 |

Patentansprüche

1. Mittel zur Leistungssteigerung bei der Tierernährung von kaltblütigen und warmblütigen Tieren, enthaltend mindestens entweder ein
 5 Uracil-Derivat der allgemeinen Formel I,



in der A und B entweder jeweils für ein Wasserstoffatom stehen oder zusammen eine Bindung bilden,

10 D Sauerstoff oder Schwefel, die Gruppe =NCN oder die Gruppe =NE bedeutet, wobei E eine Phenyl-, Benzyl-, Pyridyl, C₁-C₄-Alkylgruppe oder gemeinsam mit R¹ die Gruppe -(CH₂)_kN= bedeutet, wobei k die Zahl 2 oder 3 darstellt,

R¹, falls D ein Sauerstoffatom ist:

15

a) ein Wasserstoffatom oder

b) eine C₁-C₆-Alkylgruppe, die durch 1 bis 3 Fluor-, Chlor- oder Brom-

20 Atome, eine Hydroxy-, eine C₁-C₃-Alkoxy-, eine C₂-C₄-Alkanoyloxy-, C₁-C₃-Alkylsulfonyloxy-, eine Aminocarbonyloxy-, eine Mono- oder Di-(C₁-C₃-Alkyl)aminocarbonyloxy-, eine Mercapto-, eine C₁-C₃-Alkylmercапto-, eine Phenylmercапto-, eine Pyridylmercапto-, Pyridazinylmercапto-, Pyrimidinylmercапto-, Pyrazinylmercапto- oder eine Triazinylmercапtогruppe, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine

25 (C₁-C₄-Alkoxy)carbonylgruppe, eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylreste, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxyreste und/oder 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome substituiert sein kann, oder eine Imidazolylgruppe, die durch 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen substituiert sein kann, oder

30

eine Gruppe der Formel Ia

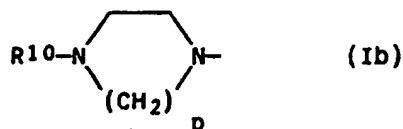


in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann,
 5 R⁶ ein Wasserstoffatom, eine C₁-C₄-Alkylgruppe, die gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 C₁-C₄-Alkylgruppen, 1 oder 2 C₁-C₄-Alkoxygruppen oder 1 oder 2 Halogenatome und/oder durch eine Nitril-, Nitro- oder Trifluormethylgruppe substituiert sein kann, oder

10 eine Gruppe der Formel R⁸R⁹N- bedeutet, in der R⁸ ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe ist, die 1- bis 2-fach durch Halogenatome, C₁-C₄-Alkylreste, C₁-C₄-Alkoxygruppen und/oder eine Nitril- und/oder Nitrogruppe substituiert sein kann, R⁹ eine C₁-C₄-Alkanoyl- oder Benzoylgruppe bedeutet oder R⁸ und R⁹ zusammen mit dem Stickstoffatom 15 eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe bilden, R⁷ dieselben Bedeutungen wie R⁶ besitzen kann,

und m für 0, 1 oder 2 steht, oder

20 eine Gruppe der Formel Ib



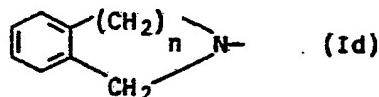
25 worin R¹⁰ einen C₁-C₃-Kohlenwasserstoffrest, der durch einen Naphthylrest oder einen Phenylrest substituiert sein kann, wobei der Phenylrest gegebenenfalls 1 bis 2 Halogenatome, 1 bis 2 C₁-C₄-Alkylreste, 1 bis 2 C₁-C₄-Alkoxyreste oder eine Trifluormethyl-, Nitro-, Hydroxy-, C₁-C₄-Alkanoyl-, (C₁-C₅-Alkoxy)-carbonyl- und/oder Cyanogruppe enthalten kann, einen Naphthylrest, einen Phenylrest, der 1- bis 3-fach durch Halogenatome, C₁-C₄-Alkylreste, C₁-C₄-Alkoxygruppen und/oder eine Trifluormethyl- oder eine C₁-C₄-Alkanoylgruppe 30 substituiert sein kann, oder einen 6-gliedrigen Heteroarylrest mit 1 bis 2 Stickstoffatomen bedeutet und p die Zahl 2 oder 3 darstellt, oder

eine Gruppe der Formel Ic,



- worin R^{11} ein Wasserstoffatom, einen $\text{C}_1\text{-}\text{C}_8\text{-Alkylrest}$, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest, der 1 bis 2 $\text{C}_1\text{-}\text{C}_4\text{-Alkylgruppen}$, 1 bis 2 $\text{C}_1\text{-}\text{C}_4\text{-Alkoxygruppen}$ und/oder 1 bis 2 Halogenatome enthalten kann, substituiert ist, eine $\text{C}_3\text{-}\text{C}_{12}\text{-Cycloalkylgruppe}$, die durch 1 bis 3 Methylgruppen, einen Phenyl- oder Benzylrest substituiert sein kann, oder einen $\text{C}_7\text{-}\text{C}_{10}\text{-bi- oder tricyclischen Alkylrest}$, der durch 1 bis 3 Methylreste substituiert sein kann, oder eine benzokondensierte $\text{C}_5\text{-}\text{C}_7\text{-Cycloalkylgruppe}$ bedeutet und R^{12} ein Wasserstoffatom oder einen $\text{C}_1\text{-}\text{C}_8\text{-Alkylrest}$ bedeutet, oder

eine Gruppe der Formel Id,



- worin n die Zahl 1, 2 oder 3 bedeutet und der aromatische Ring durch 1 bis 2 Halogenatome, 1 bis 2 $\text{C}_1\text{-}\text{C}_4\text{-Alkylreste}$ oder 1 bis 2 $\text{C}_1\text{-}\text{C}_4\text{-Alkoxyreste}$ substituiert sein kann, oder

eine Gruppe der Formel Ie,



worin G für Sauerstoff- oder Schwefelatom steht und der heterocyclische Ring durch 1 bis 2 $\text{C}_1\text{-}\text{C}_4\text{-Alkylgruppen}$ substituiert sein kann,

darstellt, oder

- c) eine $\text{C}_2\text{-}\text{C}_6\text{-Alkenylgruppe}$ bedeutet, die durch 1 Chloratom oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- 30 d) eine $\text{C}_3\text{-}\text{C}_6\text{-Alkinylgruppe}$ darstellt oder
- e) eine $\text{C}_3\text{-}\text{C}_6\text{-Cycloalkylgruppe}$ darstellt, die durch 1 bis 2 $\text{C}_1\text{-}\text{C}_3\text{-Alkylgruppen}$ und/oder 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome und/oder durch 1 Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

- f) eine Phenylgruppe darstellt, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylgruppen, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxygruppen, 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome, eine Aminogruppe, eine Mono- oder Di-C₁-C₃-Alkylaminogruppe, eine C₂-C₄-Alkanoylaminogruppe, eine Carboxygruppe oder eine C₁-C₄-Alkoxy-
- 5 carbonylgruppe substituiert sein kann, oder
- g) eine Pyridyl-, Pyridazinyl-, Pyrimidinyl-, Pyrazinyl- oder Triazinylgruppe darstellt, die durch 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen und/oder eine C₁-C₃-Alkoxygruppe, eine Hydroxygruppe, eine Aminogruppe, eine Mono- oder Di-C₁-C₃-Alkoxygruppe substituiert sein kann, oder
- 10 h) eine 5-gliedrige aromatische heterocyclische Gruppe darstellt, die als Heteroatome 1 Sauerstoff-, 1 Schwefel- und/oder 1, 2 oder 3 Stickstoffatome enthält und ggf. mit 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen substituiert ist, oder
- 15 i) eine C₁-C₆-Alkoxygruppe darstellt, die eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, ein bis zwei Chlor- oder Bromatome, eine C₁-C₃-Alkoxygruppe oder eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkyl-, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxy-, 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome, einen Trifluormethylrest oder eine Nitrogruppe substituiert sein kann, tragen kann, oder
- 20 j) eine C₃-C₆-Alkenyloxygruppe darstellt, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- 25 k) eine C₃-C₆-Alkinyloxygruppe darstellt, die durch einen Phenylrest substituiert sein kann, oder
- l) eine C₃-C₆-Cycloalkyloxygruppe darstellt, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylgruppen und/oder 1 bis 2 Chlor- oder Bromatome substituiert sein kann, oder
- 30 m) eine Phenoxygruppe darstellt, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylreste, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxygruppen, 1 bis 2 Fluor- oder Chloratome oder eine Nitrogruppe substituiert sein kann, oder
- 35 n) eine C₁-C₃-Alkylmercaptogruppe darstellt, oder
- o) die Gruppe R¹³R¹⁴N darstellt, wobei R¹³ für ein Wasserstoffatom, eine C₁-C₃-Alkyl-, eine C₃-C₄-Alkenyl- oder eine C₃-C₄-Alkinylgruppe oder eine Phenylgruppe steht und R¹⁴ ein Wasserstoffatom oder eine C₁-C₃-Alkylgruppe bedeutet, oder

R¹, falls D ein Schwefelatom darstellt, eine C₁-C₄-Alkylaminogruppe oder eine Di-(C₁-C₄-Alkyl)aminogruppe bedeutet, oder

R¹, falls D die Gruppe =N-CN darstellt, für ein Wasserstoffatom, eine C₁-C₄-Alkylgruppe, eine Phenylgruppe, eine C₁-C₄-Alkylamino- oder eine Di(C₁-C₄-Alkyl)aminogruppe steht, oder

R¹, falls D die Gruppe =NE darstellt, ein Wasserstoffatom, eine C₁-C₄-Alkylgruppe, eine Phenylgruppe, eine Pyridinylgruppe, eine C₁-C₄-Alkinylamino- oder eine Di-(C₁-C₄-Alkyl)-aminogruppe bedeutet,

R² ein Wasserstoffatom oder eine C₁-3-Alkylgruppe darstellt,

oder R¹ und R² gemeinsam eine C₂-C₄-Alkylidengruppe bilden, die durch 1 bis 2 C₁-3-Alkylgruppen und/oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann,

R³ und R⁴ unabhängig voneinander stehen für

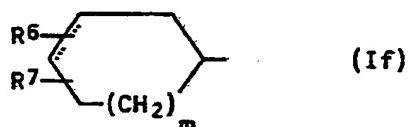
a) ein Wasserstoffatom oder

b) eine C₁-C₆-Alkylgruppe, die durch 1 bis 3-Fluor-, Chlor- oder Bromatome, eine Hydroxy-, eine C₁-C₃-Alkoxy, eine C₂-C₄-Alkanoyloxy-, eine C₁-C₃-Alkylsulfonyloxy-, eine Aminocarbonyloxy-, eine Mono- oder Di-(C₁-C₃-Alkyl)aminocarbonyloxy-, eine Mercapto-, eine C₁-C₃-Alkylmercapto-, eine Phenylmercapto-, eine Pyridylmercapto-, Pyridazinylmercapto-, Pyrimidinylmercapto-, Pyrazinylmercapto- oder eine

Triazinylmercaptogruppe, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine (C₁-C₄-Alkoxy)carbonylgruppe, eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylreste, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxyreste und/oder 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome substituiert sein kann, oder eine Imidazolylgruppe, die durch 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen substituiert sein kann, oder

eine Gruppe der Formel If,

35



in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, R⁶ ein Wasserstoffatom, eine C₁-C₄-Alkylgruppe, die gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe,

eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 C₁C₄-Alkylgruppen, 1 oder 2 C₁C₄-Alkoxygruppen oder 1 oder 2 Halogenatome und/oder durch eine Nitril-, Nitro- oder Trifluormethylgruppe substituiert sein kann, oder

5

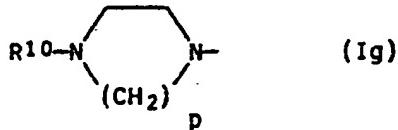
eine Gruppe der Formel R⁸R⁹N- bedeutet, in der R⁸ ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe ist, die 1- bis 2-fach durch Halogenatome, C₁-C₄-Alkylreste, C₁-C₄-Alkoxygruppen und/oder eine Nitril- und/oder Nitrogruppe substituiert sein kann, R⁹ eine C₁-C₄-Alkanoyl oder eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe darstellt, R⁷ dieselben Bedeutungen wie R⁶ besitzen kann,

10

und m für 0, 1 oder 2 steht oder

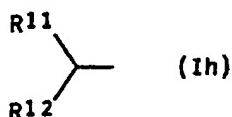
15

eine Gruppe der Formel Ig,



worin R¹⁰ einen C₁-C₃-Kohlenwasserstoffrest, der durch einen Naphthylrest oder einen Phenylrest substituiert sein kann, wobei der Phenylrest gegebenenfalls 1 bis 2 Halogenatome, 1 bis 2 C₁-C₄-Alkylreste, 1 bis 2 C₁-C₄-Alkoxyreste oder eine Trifluormethyl-, Nitro-, Hydroxy-, C₁-C₄-Alkanyl-, (C₁-C₅-Alkoxy)-carbonyl- und/oder Cyangruppe enthalten kann, einen Naphthylrest, einen Phenylrest, der 1- bis 3-fach durch Halogenatome, C₁-C₄-Alkylreste, C₁-C₄-Alkoxygruppen und/oder eine Trifluormethyl- oder eine C₁-C₄-Alkanoylgruppe substituiert sein kann, oder einen 6-gliedrigen Heteroarylrest mit 1 bis 2 Stickstoffatomen bedeutet und p die Zahl 2 oder 3 darstellt, oder

eine Gruppe der Formel Ih,



30

worin R¹¹ ein Wasserstoffatom, einen C₁-C₈-Alkylrest, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest, der 1 bis 2 C₁-C₄-Alkylgruppen, 1 bis 2 C₁-C₄-Alkoxygruppen und/oder 1 bis 2 Halogenatome enthalten kann, substituiert ist, eine C₃-C₁₂-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen, einen Phenyl- oder Benzylrest substituiert sein kann,

35

oder einen C₇-C₁₀-bi- oder tricyclischen Alkylrest, der durch 1 bis 3 Methylreste substituiert sein kann, oder eine benzokondensierte C₅-C₇-Cycloalkylgruppe bedeutet und R¹² ein Wasserstoffatom oder einen C₁-C₈-Alkylrest bedeutet, oder

5

c) eine C₂-C₆-Alkenylgruppe, die durch 1 Chloratom oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

d) eine C₃-C₆-Alkinylgruppe oder

10

e) eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylgruppen und/oder 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome und/oder durch 1 Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

15

f) eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylgruppen, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxygruppen, 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome, eine Aminogruppe, eine Mono- oder Di-C₁-C₃-Alkylaminogruppe, eine C₂-C₄-Alkanoylaminogruppe, eine Carboxygruppe oder eine C₁-C₄-Alkoxy-carbonylgruppe substituiert sein kann, oder

20

g) eine Pyridyl-, Pyridazinyl-, Pyrimidinyl-, Pyrazinyl- oder Triazinylgruppe, die durch 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen und/oder eine C₁-C₃-Alkoxygruppe, eine Hydroxygruppe, eine Aminogruppe, eine Mono- oder Di-C₁-C₃-Alkoxygruppe substituiert sein kann, oder

25

h) eine 5-gliedrige aromatische heterocyclische Gruppe, die als Heteroatome 1 Sauerstoff-, 1 Schwefel- und/oder 1, 2 oder 3 Stickstoffatome enthält und ggf. mit 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen substituiert ist, oder

30

i) eine C₁-C₆-Alkoxygruppe, die eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, ein bis zwei Chlor- oder Bromatome, eine C₁-C₃-Alkoxygruppe oder eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkyl-, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxy-, 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome, einen Trifluormethylrest oder eine Nitrogruppe substituiert sein kann, tragen kann, oder

35

j) eine C₃-C₆-Alkenyloxygruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

k) eine C₃-C₆-Alkinyloxygruppe, die durch einen Phenylrest substituiert

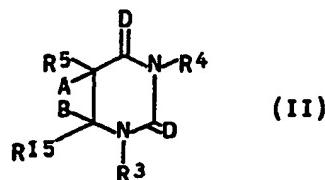
40

sein kann, oder

- 1) eine C₃-C₆-Cycloalkyloxygruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylgruppen und/oder 1 bis 2 Chlor- oder Bromatome substituiert sein kann, oder
- 5 m) eine Phenoxygruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylreste, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxygruppen, 1 bis 2 Fluor- oder Chloratome oder eine Nitrogruppe substituiert sein kann, oder
- n) eine C₁-C₃-Alkylmercaptogruppe, oder
- 10 o) die Gruppe R¹³R¹⁴N, wobei R¹³ für ein Wasserstoffatom, eine C₁-C₃-Alkyl-, eine C₃-C₄-Alkenyl- oder eine C₃-C₄-Alkinylgruppe oder eine Phenylgruppe steht und R¹⁴ ein Wasserstoffatom oder eine C₁-C₃-Alkylgruppe bedeutet; und

15 R⁵

- a) ein Wasserstoffatom
- b) eine C₁-C₆-Alkylgruppe, die durch 1-3 Fluor-, Chlor- oder Bromatome, 20 eine Hydroxy-, eine Cyano- oder Carboxygruppe substituiert sein kann,
- c) ein Halogenatom, oder
- d) eine Cyano-, Carboxy-, Nitro-, Nitroso-, Hydroxy- oder Aminogruppe, 25 die durch ein oder zwei C₁-C₆-Alkylreste mit gegebenenfalls einem Halogenatom oder einer Hydroxygruppe substituiert sein kann,
darstellt;
- 30 oder ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel II

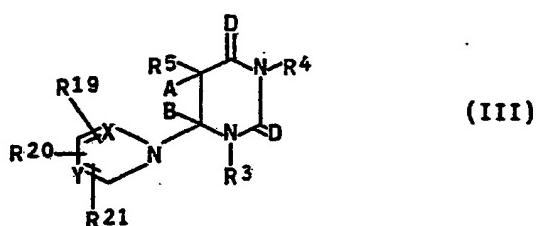


in der A, B, D, R³, R⁴ und R⁵ die für Formel I angegebenen Bedeutungen besitzen,

R¹⁵ ein Wasserstoffatom, einen C₁-C₄-Alkylrest, eine Phenyl-, eine Hydroxy-, eine C₁-C₄-Alkoxy-, eine Phenoxygruppe, die Gruppe R¹⁸-NH-CH₂-CH(OH)-CH₂O-, in der R¹⁸ die Isopropyl- oder tert.-Butylgruppe bedeutet, eine Nitro-, Trifluormethyl-, Carboxy-, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-, Aminocarbonyl- oder Cyanogruppe, ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom, eine Amino-, C₁-C₄-Alkylamino-, oder Di(C₁-C₄-Alkyl)-amino-gruppe, einen Pyrrolidin-, Piperidin- oder Morphinrest, oder die Gruppe -NH-CH₂-J, wobei J einen Pyridyl-, Furyl-, Thienyl- oder Phenylrest bedeutet, wobei der Phenylrest durch 1 bis 3 Reste aus der Gruppe Halogen, Hydroxy, C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl oder C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann,

oder eine Gruppe -NHL, worin L eine 5- oder 6-gliedrige heterocyclische Gruppe, die 1 N-, O- oder S-Atom und gegebenenfalls 1 bis 2 weitere N-Atome besitzt, bedeutet, wobei die heterocyclische Gruppe durch einen Rest aus der Gruppe Cyano, Hydroxy, C₁-C₄-Alkoxy, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di-(C₁-C₄-Alkyl)amino, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl, Aminocarbonyl oder C₁-C₄-Alkanoyl oder durch 1 bis 3 C₁-C₄-Alkylgruppen, wobei eine dieser C₁-C₄-Alkylgruppen durch eine Hydroxygruppe oder den Rest R¹⁹R²⁰N substituiert sein kann, wobei R¹⁹ und R²⁰ unabhängig voneinander Wasserstoffatome, C₁-C₄-Alkylreste, Benzyl- oder Phenethylgruppen bedeuten oder die Gruppe R¹⁹R²⁰N für eine Pyrrolidin-, Piperidin- oder Morphinrest steht, substituiert sein kann;

oder ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel III



in der R³, R⁴ und R⁵, A und B die für Formel I angegebenen Bedeutungen besitzen,

X und Y unabhängig voneinander ein N-Atom oder ein Kohlenstoffatom, das durch ein Wasserstoffatom oder einen der Reste R¹⁹, R²⁰ oder R²¹ substituiert ist, bedeuten, wobei

R¹⁹ ein Wasserstoffatom, eine C₁-C₄-Alkylgruppe, eine C₁-C₄-Hydroxy-alkylgruppe, eine C₁-C₄-Alkanoyl-, eine Hydroxycarbonyl-, eine (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-, eine Aminocarbonyl-, eine Cyanogruppe

oder eine Gruppe der Formel IIIa



bedeutet, wobei

5 R^{22} eine $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6\text{-Alkyl-}$, eine Phenyl-($\text{C}_1\text{-}\text{C}_3\text{-Alkyl-}$), eine $\text{C}_1\text{-}\text{C}_4\text{-Alkanoyl-}$, eine Benzoyl-, eine Pyridincarbonyl- oder eine $\text{C}_1\text{-}\text{C}_4\text{-Alkylsulfonylgruppe bedeutet,$

10 R^{23} ein Wasserstoffatom oder eine $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6\text{-Alkylgruppe bedeutet, oder}$

15 R^{22} und R^{23} gemeinsam mit dem N-Atom, an das sie gebunden sind, einen Pyrrolidin-, Piperidin- oder Piperazinrest bedeuten, der durch eine Phenylgruppe und/oder eine Hydroxygruppe substituiert sein kann,

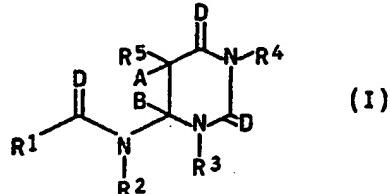
20 R^{24} eine $\text{C}_1\text{-}\text{C}_4\text{-Alkylidengruppe bedeutet, und}$

25 R^{20} und R^{21} unabhängig voneinander Wasserstoffatome oder $\text{C}_1\text{-}\text{C}_4\text{-Alkylgruppen bedeuten,$

30 oder die physiologisch verträglichen Salze der Verbindungen der allgemeinen Formel I, II und III.

2. Mittel nach Anspruch 1, enthaltend mindestens ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel I

25



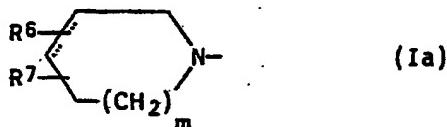
in der

A und B entweder jeweils ein Wasserstoffatom bedeuten oder zusammen eine Bindung bilden,

30 D ein Sauerstoffatom bedeutet,

R¹ die folgende Bedeutung besitzt:

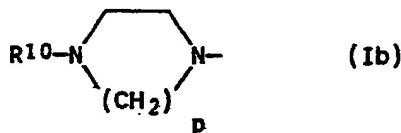
- a) ein Wasserstoffatom oder
- 5 b) eine C₁-C₃-Alkylgruppe, die durch ein Chloratom, eine Hydroxy-, eine Methoxy-, eine Acetoxy-, eine Methylmercapto-, eine Pyridyliercapto-, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine (C₁-4-Alkoxy)-carbonyl- oder eine Phenylgruppe oder eine Gruppe der Formel Ia,



- 10 in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, und R⁶ ein Wasserstoffatom, eine Methylgruppe ist, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 Methyl-, Methoxygruppen oder Chloratome substituiert sein kann, oder eine Gruppe der Formel R⁸R⁹N bedeutet, in der R⁸ ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe und R⁹ eine Propionyl- oder Benzoylgruppe bedeutet oder R⁸ und R⁹ zusammen mit dem Stickstoffatom eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe bilden, R⁷ ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Hydroxy-, eine Acetyl-, eine Ethoxycarbonyl oder eine Cyanogruppe bedeutet,
- 15

- 20 m für 1 steht, oder

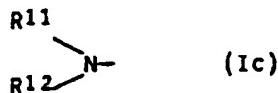
eine Gruppe der Formel Ib



- worin R¹⁰ einen Benzyl-, einen Naphthyl- oder einen Phenylrest, der 1- bis 3-fach durch Chloratome, Methyl- und/oder Methoxygruppen substituiert sein kann, oder einen Pyridylrest bedeutet und
- 25

- p die Zahl 2 bedeutet, oder

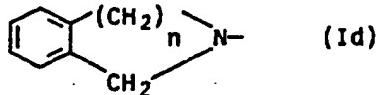
eine Gruppe der Formel Ic,



worin R^{11} einen C₁-C₃-Alkylrest, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, und R^{12} ein Wasserstoffatom oder einen Methylrest bedeuten, oder

5

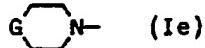
eine Gruppe der Formel Id,



worin n die Zahl 2 bedeutet, oder

10

eine Gruppe der Formel Ie,



worin G für ein Wasserstoffatom steht und der heterocyclische Ring durch 1 bis 2 C₁-C₄-Alkylgruppen substituiert sein kann, oder

15

c) eine C₂-C₄-Alkenylgruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

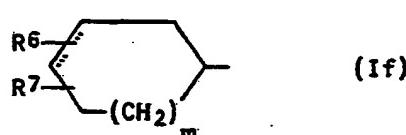
d) eine C₃-C₄-Alkinylgruppe oder

20

e) eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen und/oder 1 bis 2 Chloratome und/oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

25 f) eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen, 1 bis 2 Methoxygruppen, 1 bis 2 Chloratome, eine Carboxygruppe oder eine Ethoxy-carbonylgruppe substituiert sein kann, oder

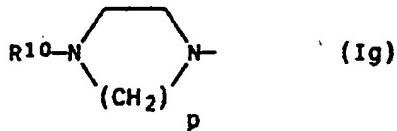
- g) eine Pyridylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen substituiert sein kann, oder
- h) eine Thiophenyl-, Furanyl-, Imidazolyl- oder Oxazolylgruppe, die gegebenenfalls mit 1 bis 3 Methylgruppen substituiert ist, oder
- i) eine C₁-C₄-Alkoxygruppe, die durch eine Methoxygruppe oder durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- 10 j) eine C₃-C₄-Akenyloxygruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- k) eine C₃-C₄-Alkinyloxygruppe, die durch einen Phenylrest substituiert sein kann, oder
- 15 l) eine C₃-C₆-Cycloalkoxygruppe oder
- m) eine Phenoxygruppe oder
- 20 n) eine Methylmercaptopgruppe oder
- o) die Gruppe R¹³R¹⁴N-, wobei R¹³ für ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Allyl- oder eine Propionylgruppe steht und R¹⁴ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe bedeutet,
- 25 R² ein Wasserstoffatom bedeutet
oder R¹ und R² gemeinsam eine C₂-C₄-Alkylidengruppe bilden, die durch 1 bis 2 Methylgruppen substituiert sein kann,
- 30 R³ und R⁴ unabhängig voneinander stehen für
- a) ein Wasserstoffatom oder
- 35 b) eine C₁-C₃-Alkylgruppe, die durch ein Chloratom, eine Hydroxy-, eine Methoxy-, eine Acetoxy-, eine Methylmercanto-, eine Pyridiylmercanto-, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine (C₁-C₄-Alkoxy)-carbonyl- oder eine Phenylgruppe oder eine Gruppe der Formel If,



in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, und R⁶ ein Wasserstoffatom, eine Methylgruppe ist, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 Methyl-, Methoxygruppen oder Chloratome substituiert sein kann, oder eine Gruppe der Formel R⁸R⁹N bedeutet, in der R⁸ ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe und R⁹ eine Propionyl- oder Benzoylgruppe bedeutet oder R⁸ und R⁹ zusammen mit dem Stickstoffatom eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe bilden, R⁷ ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Hydroxy-, eine Acetyl-, eine Ethoxycarbonyl oder eine Cyanogruppe bedeutet,

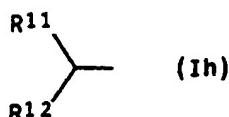
10 m für 1 steht oder

eine Gruppe der Formel Ig,



15 worin R¹⁰ einen Benzyl-, einen Naphthyl- oder einen Phenylrest, der 1- bis 3-fach durch Chloratome, Methyl- und/oder Methoxygruppen substituiert sein kann, oder einen Pyridylrest bedeutet und

20 p die Zahl 2 bedeutet, oder
eine Gruppe der Formel Ih



25 worin R¹¹ einen C₁-C₃-Alkylrest, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, und R¹² ein Wasserstoffatom oder einen Methylrest bedeuten, oder

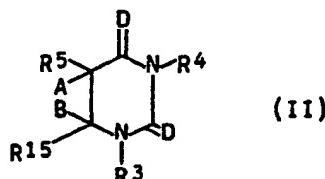
- c) eine C₂-C₄-Alkenylgruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- 30 d) eine C₃-C₄-Alkinylgruppe oder

- e) eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen und/oder 1 bis 2 Chloratome und/oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
 - 5 f) eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen, 1 bis 2 Methoxygruppen, 1 bis 2 Chloratome, eine Carboxygruppe oder eine Ethoxy-carbonylgruppe substituiert sein kann, oder
 - 10 g) eine Pyridylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen substituiert sein kann, oder
 - h) eine Thiophenyl-, Furanyl-, Imidazolyl- oder Oxazolylgruppe, die gegebenenfalls mit 1 bis 3 Methylgruppen substituiert ist, oder
- 15 i) eine C₁-C₄-Alkoxygruppe, die durch eine Methoxygruppe oder durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- 20 j) eine C₃-C₄-Alkenyloxygruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- k) eine C₃-C₄-Alkinyloxygruppe, die durch einen Phenylrest substituiert sein kann, oder
- 25 l) eine C₃-C₆-Cycloalkoxygruppe oder
- m) eine Phenoxygruppe oder
- n) eine Methylmercaptogruppe oder
- 30 o) die Gruppe R¹³R¹⁴N-, wobei R¹³ für ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Allyl- oder eine Propionylgruppe steht und R¹⁴ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe bedeutet; und
- R⁵
- 35 a) ein Wasserstoffatom
- b) eine C₁-C₃-Alkylgruppe, die endständig durch ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom, eine Hydroxy-, eine Cyano- oder Carboxygruppe substituiert sein kann,
- 40 c) ein Brom- oder Chloratom, oder

d) eine Cyano-, Carboxy-, Nitro-, Nitroso-, Hydroxy- oder Aminogruppe, die durch ein oder zwei C₁-C₃ mit gegebenenfalls endständigen Chloratom oder einer Hydroxygruppe substituiert sein kann,

5 darstellt;

oder ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel II



in der

10

A, B, D, R³, R⁴ und R⁵ die in diesem Anspruch für die Formel I angegebenen Bedeutungen besitzen; und

R¹⁵

15

a) ein Wasserstoffatom

b) einen C₁-C₄-Alkylrest,

20 c) eine Cyano-, Carboxy- oder Aminogruppe, die durch gegebenenfalls ein bis zwei C₁-C₃-Alkylgruppen substituiert sein kann

d) einen Piperidinrest

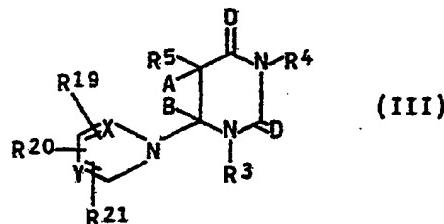
25 e) die Gruppe NHCH₂J, wobei J ein Pyridyl-, Furyl-, Thionyl- oder Phenylrest bedeutet,

f) die Gruppe NHL, worin L einen Pyridyl- oder einen Thiazolylrest bedeutet, wobei der Pyridyl- oder der Thiazolylrest durch 1-2

30 Methylgruppen substituiert sein kann,

darstellt;

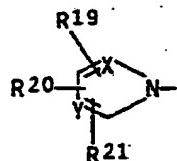
oder ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel III



in der

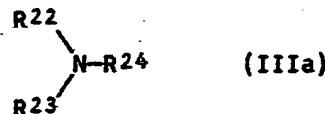
- 5 A, B, D, R³, R⁴ und R⁵ die in diesem Anspruch für die Formel I angegebenen Bedeutungen besitzen; und

der Rest



- 10 insgesamt für einen der folgenden Reste steht:
einen Imidazol-1-yl-rest, der durch 1-3 Methylgruppen oder eine Hydroxymethylgruppe substituiert sein kann,

- 15 oder einen 1,2,4-Triazol-1-yl-rest, einen Pyrazol-1-yl-rest, oder einen Pyrrol-1-yl-rest, der durch eine Hydroxymethylgruppe, eine Formylgruppe, eine Acetylgruppe oder eine Gruppe der Formel IIIa,



- 20 substituiert ist, in der R²² eine C₁-C₃-Alkyl-, eine Benzyl-, eine C₁-C₄-Alkanoyl oder eine Benzoylgruppe bedeutet, R²³ ein Wasserstoffatom oder eine C₁-C₆-Alkylgruppe bedeutet, oder R²² und R²³ gemeinsam mit dem N-Atom einen Piperidin- oder Piperazinrest darstellen, der durch eine Phenylgruppe substituiert ist, und

R²⁴ eine C₁-C₃-Alkylidengruppe bedeutet;

- 25 oder die physiologisch verträglichen Salze der Verbindungen der allgemeinen Formeln I, II und III.

3. Mittel nach einem der Ansprüche 1 oder 2 in Form von Tierfutter, Trinkwasser für Tiere, Zusatz für Tierfutter und Trinkwasser oder in Form eines Praemixes.
- 5 4. Verwendung der Uracil-Derivate der allgemeinen Formeln I, II und III gemäß einem der Ansprüche 1 bis 2 zur Leistungssteigerung bei der Tierzucht, insbesondere zur Wachstumsförderung, Verbesserung der Futterverwertung, Erhöhung des Proteinanteils und/oder Verringerung des Fettgehalts bei Tieren.

10

15

20

25

30

35

40

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No PCT/EP 89/00477

I. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER (If several classification symbols apply, indicate all) *

According to International Patent Classification (IPC) or to both National Classification and IPC

Int.Cl⁴

A 23 K 1/16

II. FIELDS SEARCHED

Minimum Documentation Searched ?

| Classification System | Classification Symbols |
|-----------------------|------------------------|
| Int.Cl ⁴ | A 23 K, C 07 D |

Documentation Searched other than Minimum Documentation
to the Extent that such Documents are Included in the Fields Searched *

III. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT*

| Category * | Citation of Document, ¹¹ with indication, where appropriate, of the relevant passages ¹² | Relevant to Claim No. ¹³ |
|------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------|
| X | US, A, 2328355 (J.J. OLESON) 31 August 1943 see page 1, left hand column, lines 1-6, 21-27, 39-44; examples 1,2; page 2, left hand column, lines 29-41, right hand column, lines 12-14; claims 1,10 | 1-4 |
| X | GB, A, 1436283 (DIAMALT) 19 May 1976 see claims, 1,6,8,9; page 1, lines 9-16, 51 - page 2, line 96; examples 1-3 | 1-4 |
| X | US, A, 4239888 (M.W. MILLER) 16 December 1980 see column 2, lines 4-22; column 3, line 44 - column 9, line 25; column 13, lines 50-54 | 1-4 |
| X | EP, A, 0107161 (CTA FINANZ AG) 2 May 1984, see page 1, line 9 - page 2, line 7; page 3, line 31 - page 4, line 27; page 5, lines 15-20,30 - page 6, line 2; examples 1-3 | 1-4 |
| | --- | 1/. |

* Special categories of cited documents: ¹⁰

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

IV. CERTIFICATION

Date of the Actual Completion of the International Search

18 July 1989 (18.07.89)

Date of Mailing of this International Search Report

8 August 1989 (08.08.89)

International Searching Authority

EUROPEAN PATENT OFFICE

Signature of Authorized Officer

III. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT (CONTINUED FROM THE SECOND SHEET)

| Category * | Citation of Document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to Claim No |
|------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------|
| X | US, A, 2456515 (J. KAMLET et al.) 14 December 1948, see column 1, lines 1-29 column 2, line 3 - column 4, line 43; claims 1,2 -- | 1,3,4 |
| X | US, A, 2438353 (C.W. TURNER et al.) 23 March 1948, see column 1 - line 1 - column 3, line 6; examples I-VI -- | 1,3,4 |
| X | DE, A, 1767274 (CHEMOFORMA) 18 May 1972 see claims 1,11-16,19,22,26,27,32,34,36; examples 1-5 ----- | 1-4 |
| | | |

**ANNEX TO THE INTERNATIONAL SEARCH REPORT
ON INTERNATIONAL PATENT APPLICATION NO.**

EP 8900477
SA 28234

This annex lists the patent family members relating to the patent documents cited in the above-mentioned international search report. The members are as contained in the European Patent Office EDP file on 03/08/89. The European Patent Office is in no way liable for these particulars which are merely given for the purpose of information.

| Patent document cited in search report | Publication date | Patent family member(s) | | Publication date |
|-------------------------------------------|---------------------|----------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------|
| US-A- 2328355 | | None | | |
| GB-A- 1436283 | 19-05-76 | None | | |
| US-A- 4239888 | 16-12-80 | None | | |
| EP-A- 0107161 | 02-05-84 | CH-B- CA-A- JP-A- | 650906 1222953 59130221 | 30-08-85 16-06-87 26-07-84 |
| US-A- 2456515 | | None | | |
| US-A- 2438353 | | None | | |
| DE-A- 1767274 | 18-05-72 | AT-A- BE-A- CH-A- FR-A- GB-A- LU-A- NL-A- US-A- | 290970 713857 505560 1569124 1193191 55923 6805419 3627892 | 15-05-71 18-10-68 15-04-71 30-05-69 28-05-70 30-07-68 21-10-68 14-12-71 |

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 89/00477

| | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------|
| I. KLASSEKIFICATION DES ANMELDUNGSGEGENSTANDS (bei mehreren Klassifikationsymbolen sind alle anzugeben) ⁶ | | |
| Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC | | |
| Int. Cl. 4. A 23 K 1/16 | | |
| II. RECHERCHIERTE SACHGEBIETE | | |
| Recherchierte Mindestprüfstoff ⁷ | | |
| Klassifikationssystem | Klassifikationssymbole | |
| Int. Cl. 4 | A 23 K, C 07 D | |
| Recherchierte nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Sachgebiete fallen ⁸ | | |
| III EINSCHLÄGIGE VERÖFFENTLICHUNGEN⁹ | | |
| Art* | Kennzeichnung der Veröffentlichung ¹¹ , soweit erforderlich unter Angabe der maßgeblichen Teile ¹² | Betr. Anspruch Nr. ¹³ |
| X | US, A, 2328355 (J.J. OLESON) 31. August 1943 siehe Seite 1, linke Spalte, Zeilen 1-6, 21-27, 39-44; Beispiele 1, 2; Seite 2, linke Spalte, Zeilen 29-41, rechte Spalte, Zeilen 12-14; Ansprüche 1, 10 -- | 1-4 |
| X | GB, A, 1436283 (DIAMALT) 19. Mai 1976 siehe Ansprüche 1, 6, 8, 9; Seite 1, Zeilen 9-16, 51 - Seite 2, Zeile 96; Beispiele 1-3 -- | 1-4 |
| X | US, A, 4239888 (M.W. MILLER) 16. Dezember 1980 siehe Spalte 2, Zeilen 4-22; Spalte 3, Zeile 44 - Spalte 9, Zeile 25; Spalte 13, Zeilen 50-54 -- | 1-4 |
| | | .. . |
| <p>* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen¹⁰: "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist "E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldeatum veröffentlicht worden ist "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldeatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist</p> <p>"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldeatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als neu oder auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist</p> | | |
| IV. BESCHEINIGUNG | | |
| Datum des Abschlusses der internationalen Recherche | Absendedatum des internationalen Recherchenberichts | |
| 18. Juli 1989 | 08 AUG 1989 | |
| Internationale Recherchenbehörde | Unterschrift des bevollmächtigten Bediensteten | |
| Europäisches Patentamt | M. VAN MOL  | |

III. EINSCHLÄGIGE VERÖFFENTLICHUNGEN (Fortsetzung von Blatt 2)

| Art * | Kennzeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der maßgeblichen Teile | Betr. Anspruch Nr. |
|-------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------|
| X | EP, A, 0107161 (CTA FINANZ AG) 2. Mai 1984 siehe Seite 1, Zeile 9 - Seite 2, Zeile 7; Seite 3, Zeile 31 - Seite 4, Zeile 27; Seite 5, Zeilen 15-20,30 - Seite 6, Zeile 2; Beispiele 1-3 -- | 1-4 |
| X | US, A, 2456515 (J. KAMLET et al.) 14. Dezember 1948 siehe Spalte 1, Zeilen 1-29; Spalte 2, Zeile 3 - Spalte 4, Zeile 43; Ansprüche 1,2 -- | 1,3,4 |
| X | US, A, 2438353 (C.W. TURNER et al.) 23. März 1948 siehe Spalte 1, Zeile 1 - Spalte 3, Zeile 6; Beispiele I-VI -- | 1,3,4 |
| X | DE, A, 1767274 (CHEMOFORMA) 18. Mai 1972 siehe Ansprüche 1,11-16,19,22,26,27, 32,34,36; Beispiele 1-5 ----- | 1-4 |

**ANHANG ZUM INTERNATIONALEN RECHERCHENBERICHT
ÜBER DIE INTERNATIONALE PATENTANMELDUNG NR.**

EP 8900477
SA 28234

In diesem Anhang sind die Mitglieder der Patentfamilien der im obengenannten internationalen Recherchenbericht angeführten Patentdokumente angegeben.
Die Angaben über die Familienmitglieder entsprechen dem Stand der Datei des Europäischen Patentamts am 03/08/89.
Diese Angaben dienen nur zur Unterrichtung und erfolgen ohne Gewähr.

| Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument | Datum der Veröffentlichung | Mitglied(er) der Patentfamilie | Datum der Veröffentlichung |
|----------------------------------------------------|-------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------|
| US-A- 2328355 | | Keine | |
| GB-A- 1436283 | 19-05-76 | Keine | |
| US-A- 4239888 | 16-12-80 | Keine | |
| EP-A- 0107161 | 02-05-84 | CH-B- 650906 CA-A- 1222953 JP-A- 59130221 | 30-08-85 16-06-87 26-07-84 |
| US-A- 2456515 | | Keine | |
| US-A- 2438353 | | Keine | |
| DE-A- 1767274 | 18-05-72 | AT-A- 290970 BE-A- 713857 CH-A- 505560 FR-A- 1569124 GB-A- 1193191 LU-A- 55923 NL-A- 6805419 US-A- 3627892 | 15-05-71 18-10-68 15-04-71 30-05-69 28-05-70 30-07-68 21-10-68 14-12-71 |

THIS PAGE BLANK (USPTO)